

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 8 月 28 日 (28.08.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/070277 A1

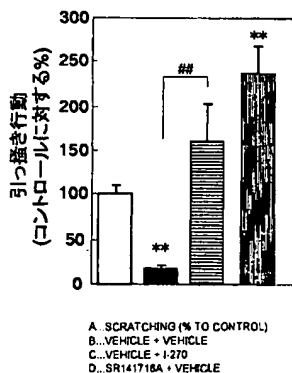
- (51) 国際特許分類⁷: A61K 45/00, 31/426, 31/435, 31/436, 31/4375, 31/4412, 31/4427, 31/4439, 31/4523, 31/4704, 31/4709, 31/4745, 31/506, 31/5377, 31/54, 31/541, 31/5415, 31/547, A61P 17/04
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-0045 大阪府 大阪市中央区 道修町 3 丁目 1 番 8 号 Osaka (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP03/01725
- (72) 発明者; および
- (22) 国際出願日: 2003 年 2 月 18 日 (18.02.2003)
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 安井 潔 (YASUI, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒561-0825 大阪府 豊中市 二葉町 3 丁目 1 番 1 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 森岡 靖英 (MORIOKA, Yasuhide) [JP/JP]; 〒561-0825 大阪府 豊中市 二葉町 3 丁目 1 番 1 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 花崎 浩二 (HANASAKI, Kohji) [JP/JP]; 〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目 1 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2002-41408 2002 年 2 月 19 日 (19.02.2002) JP

[続葉有]

(54) Title: ANTIPRURITICS

(54) 発明の名称: 抗掻痒剤

- ビークル + ビークル B
■ ビークル + t-270 C
▨ SR141718A + t-270
▩ SR141718A + ビークル D



(57) Abstract: It is intended to provide antipruritics (drugs to control itching, anti-itch agents and drugs to stop itching). It is found out that a compound having a cannabinoid receptor agonism shows an antipruritic effect.

(57) 要約:

抗掻痒剤（痒みの抑制剤、止痒剤、鎮痒剤）を提供する。

カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物に、抗掻痒作用があることを見い出した。



(74) 代理人: 山内 秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.);
〒553-0002 大阪府 大阪市福島区 鷺洲 5 丁目 1 2 番
4 号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ,
OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI
特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

明細書

抗搔痒剤

5 技術分野

本発明は、抗搔痒剤、更に詳しくは、カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物を有効成分として含有する抗搔痒剤に関する。

背景技術

- 10 浮腫などの炎症反応の他に、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎などの疾患では、痒みが発現することが知られている。痒みは、アトピー性皮膚炎や蕁麻疹といったアレルギー性皮膚疾患の主訴であるとともに、腎透析を必要とする慢性腎不全や胆汁鬱滞性の慢性肝炎などの全身性疾患でも認められる症状である。

- 15 現在は、抗搔痒剤として抗ヒスタミン薬が使用されているが、浮腫や蕁麻疹の痒みに効果はあるものの、それ以外の痒みに対する効果は決して十分とは言えず、強力な抗搔痒剤（痒みの抑制剤、止痒剤、鎮痒剤）の開発が待たれている。

- また、痒みに伴う行動、例えば、引っ掻き行動、殴打などは、上記疾患の症状を悪化させることもありうる。従って、抗搔痒剤は、痒みに伴う行動により二次的に発生する疾患、例えば、白内障、網膜剥離、炎症、感染、睡眠障害などの予防剤または治療剤としても期待できる。

一方、カンナビノイドは、1960年にマリファナの活性物質の本体として発見され、その作用は、中枢神経系作用（幻覚、多幸感、時間空間感覚の混乱）、および末梢細胞系作用（免疫抑制、抗炎症、鎮痛作用）であることが見出された。

- 25 その後、内在性カンナビノイド受容体アゴニストとして、アラキドン酸含有リン脂質から産生されるアナンダミドや2-アラキドノイルグリセロールが発見され、これら内在性アゴニストは、中枢神経系作用及び末梢細胞系作用を発現する

ことが知られている。

カンナビノイド受容体としては、1990年にカンナビノイド1型受容体が発見され、脳などの中枢神経系に分布することがわかり、そのアゴニストは神経伝達物質の放出を抑制し、幻覚などの中枢作用を示すことがわかった。また、1993年にはカンナビノイド2型受容体が発見され、脾臓などの免疫系組織に分布することがわかり、そのアゴニストは免疫系細胞や炎症系細胞の活性化を抑制し、免疫抑制作用、抗炎症作用、鎮痛作用を示すことがわかった(Nature, 1993, 365, 61-65)。

しかし、これらの文献には、カンナビノイド受容体のアゴニストが、抗搔痒作用を有することは開示されていない。

発明の開示

様々な疾患に由来する痒みに対する十分な効果を有する、強力な抗搔痒剤（痒みの抑制剤、止痒剤、鎮痒剤）を提供する。

本発明者らは、カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物に、抗搔痒作用があることを見い出した。また、このカンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物による抗搔痒作用は、カンナビノイド受容体アンタゴニスト作用を有する化合物により遮断されることを確認し、以下の発明を完成した。

すなわち、本発明は、1)カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩、又はそれらの溶媒和物を有効成分として含有する抗搔痒剤、に関する。

さらに詳しくは、以下に示す2)～14)に関する。

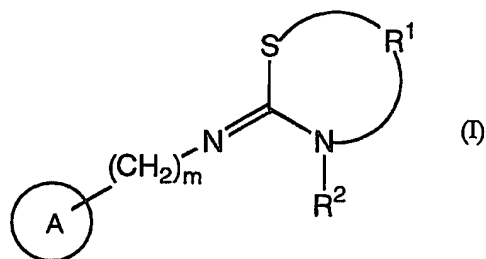
2)カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、カンナビノイド1型受容体アゴニスト作用を有する化合物である1)記載の抗搔痒剤。

3)カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、カンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を有する化合物である1)記載の抗搔痒剤。

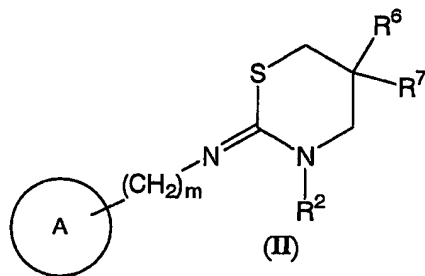
4)カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、カンナビノイド1

型受容体アゴニスト作用及びカンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を有する化合物である1)記載の抗掻痒剤。

5) カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、式(I)：



- 5 (式中、 R^1 は置換されていてもよいアルキレンであり；
 R^2 はアルキル、式： $-C(=R^3)-R^4$ (式中、 R^3 はO又はSであり、 R^4 はアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアラルキルチオ、置換されていてもよいアラルキルアミノ、アルコシアルキル、アルキルチオアルキル又は置換されていてもよいアミノアルキルを表わす)で示される基又は式： $-SO_2R^5$ (式中、 R^5 はアルキル、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよい芳香族複素環式基を表わす)で示される基であり；
 m は0～2の整数であり；
- 15 Aは置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよい芳香族複素環式基である)で示される化合物群から選択されるものである1)記載の抗掻痒剤。
- 6) R^1 がアルキレンで置換されていてもよい炭素数2～9の直鎖状又は分枝状のアルキレンであり； R^2 が式： $-C(=R^3)-R^4$ (式中、 R^3 はO又はSであり、 R^4 がアルコキシ、アルキルチオ又はアルケニルチオである)で示される
- 20 基であり； m が0であり；Aがアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びアルキルチオからなる群から選択される基で1～2箇所置換されていてもよいアリールである5)記載の抗掻痒剤。
- 7) カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、式(II)：



(式中、 R^2 は置換されていてもよい複素環式基又は式： $-C(=Z)W-R^8$ （式中、 Z はO又はS； W はO又はS； R^8 は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル又は置換されていてもよいアルキニル）で示される

5 基であり；

R^6 及び R^7 はそれぞれ独立して水素原子、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルコキシアルキル、置換されていてもよいアミノアルキル又は置換されていてもよいシクロアルキル；又は

R^6 及び R^7 は一緒になって置換されていてもよいヘテロ原子を含んでいてもよいアルキレンであり；

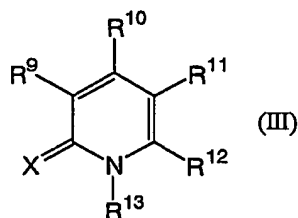
m は0～2の整数であり；

Aは置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよい芳香族複素環式基である）で示される化合物群から選択されるものである1）記載の抗搔痒剤。

8） m が0であり；Aがアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びアルキルチオからなる群から選択される基で1～2箇所置換されていてもよいアリールである7）記載の抗搔痒剤。

9） R^2 が式： $-C(=Z)W-R^8$ （式中、 Z はO又はS； W はO又はS； R^8 は置換されていてもよいアルキル又は置換されていてもよいアルケニル）で示される基であり； R^6 及び R^7 がそれぞれ独立して置換されていてもよいアルキル、又は一緒になって置換されていてもよいヘテロ原子を含んでいてもよいアルキレンである7）又は8）記載の抗搔痒剤。

10）カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、式（III）：



(式中、 R^9 は水素、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニ

5 トロ又は式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$ (式中、 Y^1 及び Y^3 はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； Y^2 は単結合、 $-O-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、 $-O-C(=O)-O-$ 、 $-O-C(=O)-NR^b-$ 、 $-O-SO_2-$ 、 $-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$ 、 $-NR^b-SO_2-$ 、 $-NR^b-C(=NH)-$ 、 $-NR^b-C(=O)-O-$ 、 $-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=O)-NR^b-SO_2-$ 、 $-NR^b-C(=S)-$ 、 $-NR^b-C(=S)-NR^b-$ 、 $-NR^b-SO_2-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=NH)-NR^b-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-O-$ 、 $-SO_2-NR^b-$ 、 $-SO_2-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=S)-$ 、 $-C(=S)-NR^b-$ 、 $-C(=S)-NR^b-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=NR^b)-$ 又は $-C(=O)-NR^b-NR^b-$ であり； R^a は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式

10 基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルであり； R^b はそれぞれ独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基、アシル、ヒドロキシ又はアルコキシである)で示される基であり；

20

- R^{10} は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^4-R^o$ （式中、 Y^4 は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； R^o は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；
- 5 R^{11} 及び R^{12} はそれぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^5-R^d$ （式中、 Y^5 は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-E$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； E は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； R^d は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；
- 15 R^{13} は水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル又は式： $-Y^6-R^o$ （式中、 Y^6 は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NH-E$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； E は単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； R^o は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；
- 20
- 25

又は、 R^{10} 及び R^{11} の組合わせ、 R^{11} 及び R^{12} の組合わせ、 R^{12} 及び R^{13} の組合わせのいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成していてもよく；

- 5 XはS又はOである)で示される化合物群から選択されるものである1)記載の抗搔痒剤。

1 1) R^a が式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$ (式中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及び R^b は10)と同意義であり； R^a は置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである)で示される基であり； R^{10} が水素又は置換されていてもよいアルキルであり； R^{11} が置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式： $-Y^4-R^d$ (式中、 Y^4 は単結合又はアルキニレンであり； R^d は10)と同意義である)で示される基であり； R^{12} が水素又は置換されていてもよいアルキルであり； R^{13} がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル又は式： $-Y^5-R^e$ (式中、 Y^5 及び R^e は10)と同意義である)で示される基であり；又は、 R^{11} 及び R^{12} は一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成していてもよい10)記載の抗搔痒剤。

20 1 2) R^a が式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$ (式中、 Y^1 は単結合であり； Y^2 は $-C(=O)-NH-$ であり； Y^3 は単結合又は置換されていてもよいアルキルであり； R^a は置換されていてもよい炭素環式基又はアシルである)で示される基であり；

R^{10} が水素であり；

R^{11} 及び R^{12} が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成し；

25 R^{13} がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキルであり；

XがS又はOである10)記載の抗搔痒剤。

1 3) カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物、そのプロドラッグ、
それらの製薬上許容される塩、又はそれらの溶媒和物を投与することを特徴とす
る掻痒の治療方法。

1 4) 抗掻痒剤を製造するためのカンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する
5 化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩、又はそれらの溶媒和
物の使用。

図面の簡単な説明

図 1 は、カンナビノイド 1 型受容体アゴニスト作用を有する化合物に抗掻痒作
10 用があることを示す図である。X 軸は試験サンプルを表わし、Y 軸はコントロール
に対する相対的引っ掻き行動を百分率 (%) で表わす。

発明を実施するための最良の形態

痒みの評価は、Eur. J. Pharmacol. 1995; 275: 229-233 に記載の方法に基づい
15 て行うことができる。即ち、マウスの背部に起痒物質を注射し、マウスが後肢で
注射部位を引っ掻く回数をカウントすることによって評価する方法である。起痒
物質としては種々の物質が挙げられるが、肥満細胞の活性化物質である
compound 48/80 も汎用される物質の一つである。

本発明者は、上記の試験において、カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有
20 する化合物を被検化合物として使用し、その効果を調べた。その結果、カンナビ
ノイド 1 型受容体アゴニスト作用を有する化合物、カンナビノイド 2 型受容体ア
ゴニスト作用を有する化合物のいずれもが、抗掻痒作用を有することを見い出し
た。また、カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、compound
48/80 による痒みのみならず、Substance P による痒みも抑制することを見い出
25 した。

さらに、本発明者は、カンナビノイド 1 型受容体アゴニスト作用を有する化合
物による抗掻痒効果が、カンナビノイド 1 型受容体アンタゴニスト作用を有する

化合物により遮断されること、カンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を有する化合物による抗搔痒効果が、カンナビノイド2型受容体アンタゴニスト作用を有する化合物により遮断されることを確認した。

なお、カンナビノイド1型受容体アンタゴニスト作用を有する化合物としては、
5 FEBS Lett. 1994, Aug, 22, 350(2-3), p240-244に記載されているSR141716Aを使用し、カンナビノイド2型受容体アンタゴニスト作用を有する化合物としては、
J. Pharmacol. Exp. Ther. 1998, Feb, 284(2), p644-650に記載されているSR144528を使用した。

カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物としては、カンナビノイド受容体に対するアゴニスト作用を有する化合物であれば、いかなる化学構造の化合物であってもよい。すなわち、その化学構造を限定するものではない。特に、カンナビノイド受容体に対する親和性 (K_i 値) 及び cAMP生成に対する阻害活性 (IC_{50} 値) が、1000 nmol/L 以下のものが好ましく、特に300 nmol/L 以下、さらには100 nmol/L 以下のものが好ましい。これら K_i 値及び IC_{50} 値は、公知の方法を使用して測定することができる。例えば、本明細書記載の実施例1及び2に従って測定することができる。

例えば、カンナビノイド受容体アゴニストとしては、以下の化合物が挙げられる。

- (1) 5) 記載の化合物、
- 20 (2) 6) 記載の化合物、
- (3) 7) 記載の化合物、
- (4) 8) 記載の化合物、
- (5) 9) 記載の化合物、
- (6) 10) 記載の化合物、
- 25 (7) 11) 記載の化合物、
- (8) 12) 記載の化合物、
- (9) WO97/29079記載の化合物、

- (10) WO99/02499記載の化合物、
(11) WO00/40562記載の化合物、
(12) アナンドミド、
(13) 2-アラキドノイルグリセロール、
5 (14) 1(3)-アラキドノイルグリセロール、
(15) パルミトイルエタノールアミド、
(16) ドロナビノール（デルタ9-テトラヒドロカンナビノール）、
(17) ナビロン、
(18) Exp. Opin. Ther. Patents (1998) 8(3): 301-313記載の化合物、
10 (19) WO98/41519記載の化合物、
(20) US3968125、EP570920、WO94/01429、US4260764、US4371720、
US5605906、WO96/18391、WO96/18600、US5081122、US5292736、WO97/00860、
US5532237のいずれかに記載の化合物、
(21) WO2000-10968記載の化合物、
15 (22) DE 11115886A1記載の化合物、
(23) DE 19837627記載の化合物、
(24) Exp. Opin. Ther. Patents (2002) 12 (10) : 1475-1489記載の化合物、
(25) WO02/42248記載の化合物

等が挙げられる。

- 20 (1) 又は (2) 記載の化合物としては、WO01/19807記載の化合物が挙げられる。上記 (3) ~ (5) のいずれかに記載の化合物としては、特願平2001-65386記載の化合物が挙げられる。上記 (6) ~ (8) のいずれかに記載の化合物としては、PCT/JP01/11427に記載の化合物が挙げられる。

上記 (9) 記載の化合物としては、以下の化合物が好ましい。

- 25 (E) - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシフェニル) アクリルアミド、 3 - (4 - エトキシ - 3 - ベンチルオキシフェニル) - (E) - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル)

エチル〕アクリルアミド、 3-〔3, 4-ジベンチルオキシフェニル〕-(E)
-N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕アクリルアミド、 (E)-
N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕-3-(4-メトキシ-3-ブ
チルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)-N-〔2-(4-ヒドロキシ
5 フェニル)エチル〕-3-(4-メトキシ-3-ヘキシルオキシフェニル)アク
リルアミド、 (E)-N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕-3-
(4-メトキシ-3-ヘブチルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)-N
-〔2-(3-ヒドロキシフェニル)エチル〕-3-(4-メトキシ-3-ベン
チルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)-N-〔2-(2-ヒドロキシ
10 フェニル)エチル〕-3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アク
リルアミド、 (E)-N-〔2-(4-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル〕
-3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)
-N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕-N-メチル-3-(4-メ
トキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)-N-〔2-
15 (4-ヒドロキシフェニル)エチル〕-3-(3-イソベンチルオキシ-4-メ
トキシフェニル)アクリルアミド、 3-〔3-(2-エチルブチルオキシ)-
4-メトキシフェニル〕-(E)-N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチ
ル〕アクリルアミド、 (E)-N-〔2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシフ
ェニル)エチル〕-3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アクリ
20 ルアミド、 3-〔3-(1, 1-ジメチルヘブチル)-4-メトキシフェニル〕
-(E)-N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕アクリルアミド、 (E)
-N-〔2-(3, 4-ジヒドロキシフェニル)エチル〕-3-〔3-(1, 1
-ジメチルヘブチル)-4-メトキシフェニル〕アクリルアミド、 3-(3-
ヘキシル-4-メトキシフェニル)-(E)-N-〔2-(4-ヒドロキシフェ
25 ニル)エチル〕アクリルアミド、 (E)-N-(4-アミノ-3-ベンチルオ
キシフェニル)-N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕アクリルアミ
ド、 (E)-N-(4-アミノ-3-ベンチルオキシフェニル)-N-〔2-

- (4-ニトロフェニル)エチル}アクリルアミド、 3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)-(E)-N-[2-(4-ベンチルオキシフェニル)エチル}アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-メトキシフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アクリルアミド、 3-
- 5 -(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)-(E)-N-(2-モルホリノエチル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(3,4-ジヒドロキシフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アクリルアミド、 2-[2-{3-(3-ベンチルオキシ-4-メトキシフェニル)アクリロイルアミノ}エチル}ピリジン-N-オキシド、 (E)-N-[2-
- 10 (4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベンチルアミノフェニル)アクリルアミド、 3-[3-(N', N'-ジベンチルアミノ)-4-メトキシフェニル]-(E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル}アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-(3-ベンチルアミノ-4-ベンチルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-[3-(N'-
- 15 -メチル-N'-ベンチルアミノ)-4-メトキシフェニル]アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベンチルチオフエニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-(4-ベンチルオキシ-3-ベンチルチオフ
- 20 エニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-アミノフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-(3-ベンチルオキシ-4-ベンチルチオフエニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-3-(3-ベンチルオキシ-4-メチルチオフ
- 25 エニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-アミノフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベンチルチオフエニル)アクリルアミド、 (E)-N-[2-(4-ニトロフェニル)エチル]-3-(4-メトキシ-3-ベン

チルチオフェニル) アクリルアミド、 (E) - N - [2 - (イミダゾール - 4
 - イル) エチル] - 3 - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルチオフェニル) アクリル
 アミド、 (E) - N - [2 - (4 - ニトロフェニル) エチル] - 3 - (4 - メ
 トキシ - 3 - ベンチルアミノフェニル) アクリルアミド、 (E) - N - [2 -
 5 (イミダゾール - 4 - イル) エチル] - 3 - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルアミ
 ノフェニル) アクリルアミド、 (E) - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル)
 エチル] - 3 - (4 - メチルアミノ - 3 - ベンチルオキシフェニル) アクリルア
 ミド、 (E) - N - [2 - (4 - アミノフェニル) エチル] - 3 - (4 - メト
 キシ - 3 - ベンチルアミノフェニル) アクリルアミド、 (E) - N - [2 - (4
 10 - ニトロフェニル) エチル] - 3 - (4 - メチルアミノ - 3 - ベンチルオキシフ
 ェニル) アクリルアミド、 3 - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシフェニル)
 - (E) - N - [2 - (4 - チオフェン - 2 - イル) エチル] アクリルアミド、 (E)
 - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - [(N' - メチル - N'
 - ベンチルアミノ) - 4 - ベンチルオキシフェニル] アクリルアミド、 (E)
 15 - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - (4 - ベンチルアミノ
 - 3 - ベンチルオキシフェニル) アクリルアミド、 (E) - N - [2 - (4 -
 シアノフェニル) エチル] - 3 - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシフェニル)
 アクリルアミド、 (E) - N - [2 - (4 - カルバモイルフェニル) エチル] -
 3 - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシフェニル) アクリルアミド、 N - [2
 20 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシベ
 ンズアミド、 4 - エトキシ - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル]
 - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 3, 4 - ジベンチルオキシ - N - [2 -
 (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] ベンズアミド、 4 - ジメチルアミノ - N
 - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - ベンチルオキシベンズアミ
 25 ド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - ベンチルアミノ -
 4 - メトキシベンズアミド、 3 - プチルオキシ - N - [2 - (4 - ヒドロキシ
 フェニル) エチル] - 4 - メトキシベンズアミド、 3 - ヘキシルオキシ - N -

[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-メトキシベンズアミド、 3-
-ヘブチルオキシ-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-メト
キシベンズアミド、 N-[2-(3-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-メ
トキシ-3-ベンチルオキシベンズアミド、 N-[2-(2-ヒドロキシフェ
5 ニル)エチル]-4-メトキシ-3-ベンチルオキシベンズアミド、 N-[2-
-(4-ヒドロキシシクロヘキシル)エチル]-4-メトキシ-3-ベンチルオ
キシベンズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-N-メ
チル-4-メトキシ-3-ベンチルオキシベンズアミド、 3-イソベンチルオ
キシ-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-メトキシベンズア
10 ミド、 3-(2-エチルブチルオキシ)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニ
ル)エチル]-4-メトキシベンズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシ-3-
-メトキシフェニル)エチル]-4-ヒドロキシ-3-ベンチルオキシベンズア
ミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-ヒドロキシ-3-
-ベンチルオキシベンズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチ
15 ル]-4-ヒドロキシ-N-メチル-3-ベンチルオキシベンズアミド、 3-
(1,1-ジメチルヘブタン)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-
4-メトキシベンズアミド、 N-[2-(3,4-ジヒドロキシフェニル)
エチル]-3-(1,1-ジメチルヘブタン)-4-メトキシベンズアミド、 3-
(1,1-ジメチルヘブタン)-N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ
20 フェニル)エチル]-4-メトキシベンズアミド、 3-(1,1-ジメチルヘ
ブタン)-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-ヒドロキシベ
ンズアミド、 N-[2-(3,4-ジヒドロキシフェニル)エチル]-3-(1,
1-ジメチルヘブタン)-4-ヒドロキシベンズアミド、 3-ヘキシル-N-
[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-4-メトキシベンズアミド、 N-
25 -[2-(4-アミノフェニル)エチル]-3,4-ジベンチルオキシベンズア
ミド、 3,4-ジヘキシルオキシ-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エ
チル]ベンズアミド、 4-メトキシ-N-[2-(4-ベンチルオキシフェニル)

- ル) エチル] - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 4 - メトキシ - N - (2 - モルホリノエチル) - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 4 - メトキシ - N - [2 - (4 - プロペン - 2 - イルオキシフェニル) エチル] - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メトキシ - N - [2 - (フェニルスルフィニル) エチル] - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 N - [2 - (3, 4 - ジヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 N - [2 - (4 - アセトキシフェニル) エチル] - 4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシ - N - (E) - フェニルチオピニルベンズアミド、 N - [2 - (4 - アセトキシフェニル) エチル] - N - エチル - 4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 4 - [2 - {N - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシベンゾイル) アミノ} エチル] ピリジン - N - オキシド、 3 - [2 - {N - (4 - メトキシ - 3 - ベンチルオキシベンゾイル) アミノ} エチル] ピリジン - N - オキシド、 3 - ジベンチルアミノ - N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メトキシベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - イソヘキシル - 4 - メトキシベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メトキシ - 3 - (N' - メチル - N' - ベンチルアミノ) ベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - ベンチルアミノ - 4 - ベンチルオキシベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - ベンチルアミノ - 3 - ベンチルオキシベンズアミド、 3, 4 - ジベンチルオキシ - N - [2 - (4 - スルファモイルフェニル) エチル] ベンズアミド、 3, 4 - ジベンチルオキシ - N - [2 - (イミダゾール - 4 - イル) エチル] ベンズアミド、 3, 4 - ジベンチルオキシ - N - [2 - (4 - ニトロフェニル) エチル] ベンズアミド、 3, 4 - ジベンチルオキシ - N - [2 - (4 - フルオロフェニル) エチル] ベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 3 - ベンチルオキシ - 4 - プロペン - 2 - イルベンズアミド、 N - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - プロピルオキシ - 3 - ベンチルオキシベ

ンズアミド、 3, 4-ジブチルオキシ-N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)
 エチル] ベンズアミド、 3, 4-ジヘプチルオキシ-N-[2-(4-ヒドロ
 キシフェニル) エチル] ベンズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)
 エチル]-4-メチルアミノ-3-ペンチルオキシベンズアミド、 N-[2-
 5 (4-ヒドロキシフェニル) エチル]-3, 4-ジペンチルアミノベンズアミド、
 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル) エチル]-3-(N'-メチル-N'-
 ペンチルアミノ)-4-ペンチルオキシベンズアミド、 4-アミノ-N-[2-
 -(4-ヒドロキシフェニル) エチル]-3-ペンチルオキシベンズアミド、 N-
 [2-(4-ヒドロキシフェニル) エチル]-4-メトキシ-3-ペンチルチ
 10 オベンズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル) エチル]-4-ペン
 チルオキシ-3-ペンチルチオベンズアミド、 3, 4-ジペンチルオキシ-N-
 [2-(2-チエニル) エチル] ベンズアミド、 3, 4-ジペンチルオキシ
 -N-[2-(5-ヒドロキシインドール-3-イル) エチル] ベンズアミド、 3,
 4-ジペンチルオキシ-N-[2-(4-メチルアミノフェニル) エチル] ベン
 15 ズアミド、 N-[2-(4-ジメチルアミノフェニル) エチル]-3, 4-ジ
 ペンチルオキシベンズアミド、 4-ブチルアミノ-N-[2-(4-ヒドロ
 キシフェニル) エチル]-3-ペンチルオキシベンズアミド、 N-[2-(4-
 ヒドロキシフェニル) エチル]-4-ホルミルアミノ-3-ペンチルチオベン
 ズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル) エチル]-4-メチルチオ
 20 -3-ペンチルオキシベンズアミド、 N-[2-(4-ヒドロキシフェニル)
 エチル]-3-ペンチルオキシ-4-ペンチルチオベンズアミド、 N-[2-
 (4-ヒドロキシフェニル) エチル]-3-(4-ヒドロキシブチルオキシ)-
 4-メトキシベンズアミド、 N-[2-(4-アミノフェニル) エチル]-4-
 -メトキシ-3-ペンチルチオベンズアミド、 4-メトキシ-N-[2-(4-
 25 -ニトロフェニル) エチル]-3-ペンチルチオベンズアミド、 N-[2-(イ
 ミダゾール-4-イル) エチル]-4-メトキシ-3-ペンチルチオベンズアミ
 ド、 N-[2-(4-アミノフェニル) エチル]-4-ペンチルオキシ-3-

- ペンチルチオベンズアミド、N-〔2-(4-ニトロフェニル)エチル〕-4-
 -ペンチルオキシ-3-ペンチルチオベンズアミド、N-〔2-(イミダゾール
 -4-イル)エチル〕-4-ペンチルオキシ-3-ペンチルチオベンズアミド、
 2-〔2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル〕-5-メトキシ-4-ペンチル
 5 オキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、2-〔2-(4-ベン
 ジルオキシフェニル)エチル〕-5-メトキシ-4-ペンチルオキシ-2, 3-
 ジヒドロイソインドール-1-オン、5-メトキシ-2-〔2-(4-ニトロ
 フェニル)エチル〕-4-ペンチルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-
 1-オン、2-〔2-(4-メチルフェニル)エチル〕-5-メトキシ-4-
 10 ペンチルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、4, 5-ジペ
 ンチルオキシ-2-〔2-(イミダゾール-4-イル)エチル〕-2, 3-ジヒ
 ドロイソインドール-1-オン、2-〔2-(4-ベンジルオキシフェニル)
 エチル〕-4, 5-ジペンチルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-
 オン、4, 5-ジペンチルオキシ-2-〔2-(4-ニトロフェニル)エチル〕
 15 -2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、2-〔2-(4-アミノフェ
 ニル)エチル〕-4, 5-ジペンチルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール
 -1-オン、4, 5-ジペンチルオキシ-2-〔2-(4-ヒドロキシフェニ
 ル)エチル〕-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、4, 5-ジペ
 ンチルオキシ-2-〔2-(4-メチルアミノフェニル)エチル〕-2, 3-ジヒ
 20 ドロイソインドール-1-オン、2-〔2-(4-ジメチルアミノフェニル)
 エチル〕-4, 5-ジペンチルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-
 オン、2-〔2-(4-アミノフェニル)エチル〕-5-メトキシ-4-ペン
 チルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、2-〔2-(4-
 ヒドロキシフェニル)エチル〕-5-メトキシ-4-ペンチルアミノ-2, 3-
 25 ジヒドロイソインドール-1-オン、5-メトキシ-4-ペンチルオキシ-2
 -〔2-(4-ピリジン)エチル〕-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オ
 ン、2-〔2-(4-ジメチルアミノフェニル)エチル〕-5-メトキシ-4

-ベンチルオキシ-2, 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、5-メトキシ
 -2-[2-(4-メチルアミノフェニル)エチル]-4-ベンチルオキシ-2,
 3-ジヒドロイソインドール-1-オン、2-[2-(4-ベンジルオキシフェ
 ニル)エチル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1
 5 -オン、2-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-6-メトキシ-5
 -ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1-オン、2-[2-(4-ピリジ
 ル)エチル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1-
 オン、4-[2-(6-メトキシ-1-オキソ-5-ベンチルオキシ-1 H-
 イソキノリン-2-イル)エチル]フェニルアセタート、6-メトキシ-2-
 10 [2-(4-ニトロフェニル)エチル]-5-ベンチルオキシ-2 H-イソキノ
 リン-1-オン、2-[2-(4-メチルフェニル)エチル]-6-メトキシ
 -5-ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1-オン、6-メトキシ-5-
 ベンチルオキシ-2-(2-フェニルエチル)-2 H-イソキノリン-1-オン、
 2-[2-(4-アセチルアミノフェニル)エチル]-6-メトキシ-5-ベン
 15 チルオキシ-2 H-イソキノリン-1-オン、5, 6-ジベンチルオキシ-2
 -[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-2 H-イソキノリン-1-オン、
 2-[2-(4-アミノフェニル)エチル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキ
 シ-2 H-イソキノリン-1-オン、2-[2-(4-アミノフェニル)エチ
 ル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1-オン塩酸
 20 塩、2-[2-(4-ジメチルアミノフェニル)エチル]-6-メトキシ-5
 -ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1-オン、2-[2-(4-メチル
 アミノフェニル)エチル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-2 H-イソキ
 ノリン-1-オン、6-メトキシ-2-[2-(4-ピペリジノフェニル)エ
 チル]-5-ベンチルオキシ-2 H-イソキノリン-1-オン、および 6-メ
 25 トキシ-2-[2-(4-ピリジル)エチル]-5-ベンチルオキシ-2 H-イ
 ソキノリン-1-オン塩酸塩、6-メトキシ-2-[2-(4-オキソシクロヘ
 キシル)エチル]-5-ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ-2 H-イソキノリ

ン-1-オン、 4-[2-(6-メトキシ-1-オキソ-5-ベンチルオキシ
-3, 4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)エチル]フェニルアセタ
ート、 2-[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-6-メトキシ-5-
ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ-2H-イソキノリン-1-オン、 2-(2
5 -フェニルエチル)-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ-
2H-イソキノリン-1-オン、 2-[2-(4-アセチルアミノフェニル)
エチル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ-2H-イソ
キノリン-1-オン、 6-ヒドロキシ-2-[2-(4-ヒドロキシフェニル)
エチル]-5-ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ-2H-イソキノリン-1-
10 オン、 2-[2-(4-メチルフェニル)エチル]-6-メトキシ-5-ベン
チルオキシ-3, 4-ジヒドロ-2H-イソキノリン-1-オン、 2-[2-
(4-アミノフェニル)エチル]-6-メトキシ-5-ベンチルオキシ-3, 4-
ジヒドロ-2H-イソキノリン-1-オン、 6-メトキシ-5-ベンチルオ
キシ-2-[2-(4-ピリジル)エチル]-3, 4-ジヒドロ-2H-イソキ
15 ノリン-1-オン、 6-メトキシ-1-オキソ-5-ベンチルオキシ-3, 4-
ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボン酸 N-(4-アミノフェニル)
アミド、 6-メトキシ-1-オキソ-5-ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ
-1H-イソキノリン-2-カルボン酸 N-[(4-アミノフェニル)メチル]
アミド、 6-メトキシ-1-オキソ-5-ベンチルオキシ-3, 4-ジヒドロ-
20 1H-イソキノリン-2-カルボン酸 N-(4-ニトロフェニル)アミド、
7-メトキシ-3-[2-(4-ニトロフェニル)エチル]-8-ベンチルオキ
シ-(1H, 3H)-キナゾリン-2, 4-ジオン、 7-メトキシ-3-[2-
(4-ピリジル)エチル]-8-ベンチルオキシ-(1H, 3H)-キナゾリ
ン-2, 4-ジオン、 3-[2-(4-アミノフェニル)エチル]-7-メト
25 キシ-8-ベンチルオキシ-(1H, 3H)-キナゾリン-2, 4-ジオン、 3-
[2-(4-ヒドロキシフェニル)エチル]-7-メトキシ-8-ベンチルオ
キシ-(1H, 3H)-キナゾリン-2, 4-ジオン、 3-[2-(4-メチ

ルアミノフェニル) エチル) - 7-メトキシ-8-ベンチルオキシ- (1 H, 3 H) - キナゾリン-2, 4-ジオン、3-〔2-(4-ジメチルアミノフェニル) エチル) - 7-メトキシ-8-ベンチルオキシ- (1 H, 3 H) - キナゾリン-2, 4-ジオン、7-メトキシ-8-ベンチルオキシキノリン-3-カルボン酸

5 N-〔2-(4-ピリジル) エチル) アミド、7-メトキシ-8-ベンチルオキシキノリン-3-カルボン酸 N-〔2-(4-ヒドロキシフェニル) エチル) アミド、7-メトキシ-8-ベンチルオキシキノリン-3-カルボン酸 N-〔2-(4-アミノフェニル) エチル) アミド、7-メトキシ-8-ベンチルオキシキノリン-3-カルボン酸 N-〔2-(4-ニトロフェニル) エチル) アミド、および 7-メトキシ-8-ベンチルオキシキノリン-3-カルボン酸

10 N-〔2-(イミダゾール-4-イル) エチル) アミド、2-(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)-4, 4-ジメチル-4, 5-ジヒドロオキサゾール、2-(4-メトキシ-3-ベンチルチオフェニル)-4, 4-ジメチル-4, 5-ジヒドロオキサゾール、2-(3, 4-ジベンチルオキシフェニル)-4, 4-ジメチル-4, 5-ジヒドロオキサゾール、2-(4-メチルチオ-3-ベンチルオキシフェニル)-4, 4-ジメチル-4, 5-ジヒドロオキサゾール、2-(3-ベンチルオキシ-4-ベンチルチオフェニル)-4, 4-ジメチル-4, 5-ジヒドロオキサゾール、2-(4-ベンチルオキシ-3-ベンチルチオフェニル)-4, 4-ジメチル-4, 5-ジヒドロオキサゾール、2-

15 -(4-メトキシ-3-ベンチルオキシフェニル)-5-(2-ピリジル)-4, 5-ジヒドロオキサゾール。

上記(10)記載の化合物としては、以下の化合物が好ましい。

7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミド、7-メトキシ-

25 2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-アミノベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2-(4-アミノフェニル)

エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-アミノフェニル) アミド。

上記 (11) 記載の化合物としては、以下の化合物が好ましい。

- 7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1,2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸
- 5 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-アミノベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-アミノフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-アミノフェニル) アミド塩酸塩、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、8-エトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-ヒドロキシフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-ピリジルメチル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピベリジノエチル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-モルホリノエチル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3-ピリジルメチル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジルメチル) アミド、8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-フェニルエチル) アミド、8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミド、8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミド塩酸塩、8-エトキ
- 20
- 25

- シー7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオ
 ロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒ
 ドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (2-フルオロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ
 -2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (3-フ
 5 ルオロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-
 ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル) エチル]
 アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カル
 ボン酸 [2- (4-クロロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチ
 ルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-フェニルエチル) アミド、7-メ
 10 トキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-メ
 チルベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキ
 ノリン-3-カルボン酸 (4-フルオロベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ブ
 ロボキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミ
 ド、7-メトキシ-2-オキソ-8-プロボキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2-
 15 - (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-プロボキシ-1,
 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-ヒドロキシフェニル) エチル] アミド、7-
 -メトキシ-2-オキソ-8-プロボキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-
 -メチレンジオキシベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-プロボキシ-1, 2-
 ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-フェニルエチル) アミド、7, 8-ジメトキシ-2-
 20 オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル]
 アミド、7-メトキシ-2-オキソ-6-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カル
 ボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、7-メトキシ-2-オキソ-6-ベン
 チルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル)
 アミド、7-メトキシ-2-オキソ-6-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カル
 25 ボン酸 (2-モルホリノエチル) アミド、8-エトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジ
 ヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、1-メチルー
 7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2

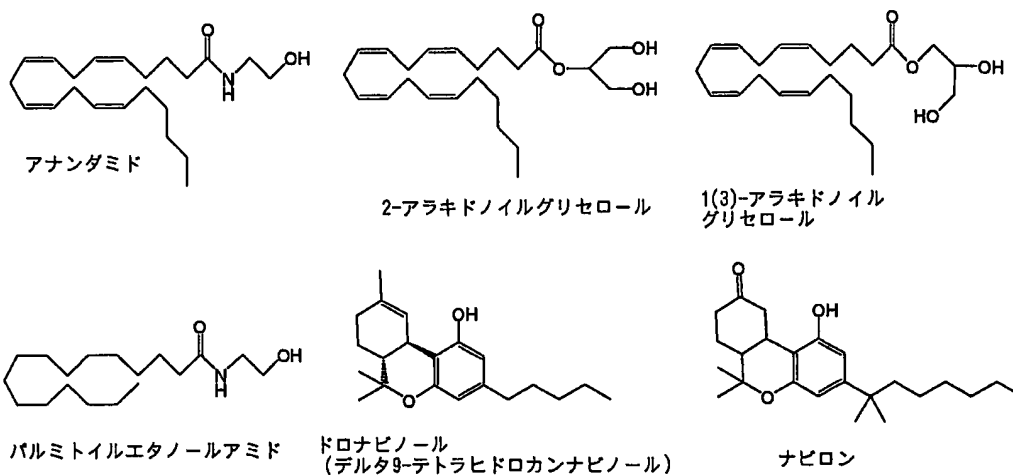
- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イルエチル) アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-モルホリノエチル) アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-ピリジルメチル) アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-フルオロベンジル) アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-ヒドロキシフェニル) エチル] アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-6-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-6-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (2-モルホリノエチル) アミド、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-6-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、7, 8-ジペンチルオキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、8-ヒドロキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-ジヒドロキシベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-ヒドロキシ-3-メトキシベンジル) アミド、1-O- {2-ヒドロキシ-5- [(7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロ-3-キノリル) カルボニルアミノメチル] フェニル} グルコシド ウロン酸、1-O- {2-ヒドロキシ-4- [(7-メトキシ-2-オキソ-8-ペンチルオキシ-1, 2-ジヒドロ-3-キノリル) カルボニルアミノメチル] フェニル} グルコシド ウロン酸、5- [(7-メトキシ-3- [(3, 4-メチレンジオキシベンジル) カルバモイル] -2-オキソ-1, 2-ジヒドロ-8-キノリルオキシ] ペンタン酸、5- [(7-メトキシ-3- [(3-ヒドロキシ-4-メトキシベンジル) カルバモイル] -2-オキ

- ソー1, 2-ジヒドロ-8-キノリルオキシ] ペンタン酸、8- (5-ヒドロキシベンチルオキシ) -7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、8- (5-ヒドロキシベンチルオキシ) -7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (4-ヒドロキシ-3-メトキシベンジル)
- 5 アミド、8- (4-ヒドロキシベンチルオキシ) -7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8- (4-オキソベンチルオキシ) -1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、8- (3-ヒドロキシベンチルオキシ) -7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、7-メトキシ-2-オキソ-8- (3-オキソベンチルオキシ) -1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、8- (2-ヒドロキシベンチルオキシ) -7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 (3, 4-メチレンジオキシベンジル) アミド、7, 8-ジヒドロキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸 [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミド、8-ブトキシ-3-ヒドロキシメチル-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン、8-エトキシ-3-ヒドロキシメチル-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン、N- (4-フルオロフェニル) カルバミン酸 (8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イル) メチルエステル、N-ピリジン-4-イルカルバミン酸 (8-エトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イル) メチルエステル、3-ジメチルアミノメチル-8-エトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン、8-ブトキシ-3-アミノメチル-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン、8-エトキシ-7-メトキシ-3-モルホリノメチル-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン、N- [(8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イル) メチル] -N' - (4-フルオロフェニル) ウレア、N- [(8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-イル) メチル] - (4-ヒドロキシフェニル) アセトアミド、
- 25 7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸メチルエステル、7-メトキシ-2-オキソ-6-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3

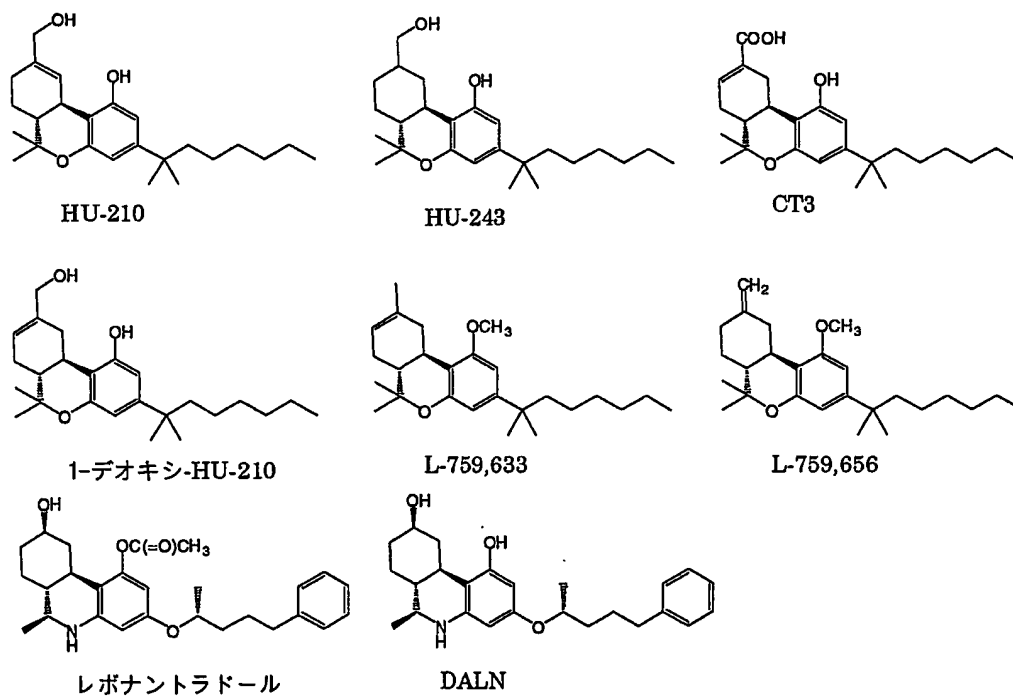
ーカルボン酸メチルエステル、1-メチル-7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-
1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸メチルエステル、1-メチル-7-メトキシ-2-オ
キソ-6-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸メチルエステル、
7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸、
5 8-ブトキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸、8-エ
トキシ-7-メトキシ-2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸、7-メトキシ
-2-オキソ-8-フロボキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸、7-メトキシ-2
-オキソ-6-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸、1-メチル-7
-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カルボン酸、1
10 -メチル-7-メトキシ-2-オキソ-6-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-カ
ルボン酸、7-メトキシ-2-オキソ-8-ベンチルオキシ-1, 2-ジヒドロキノリン-3-
カルボキサミド。

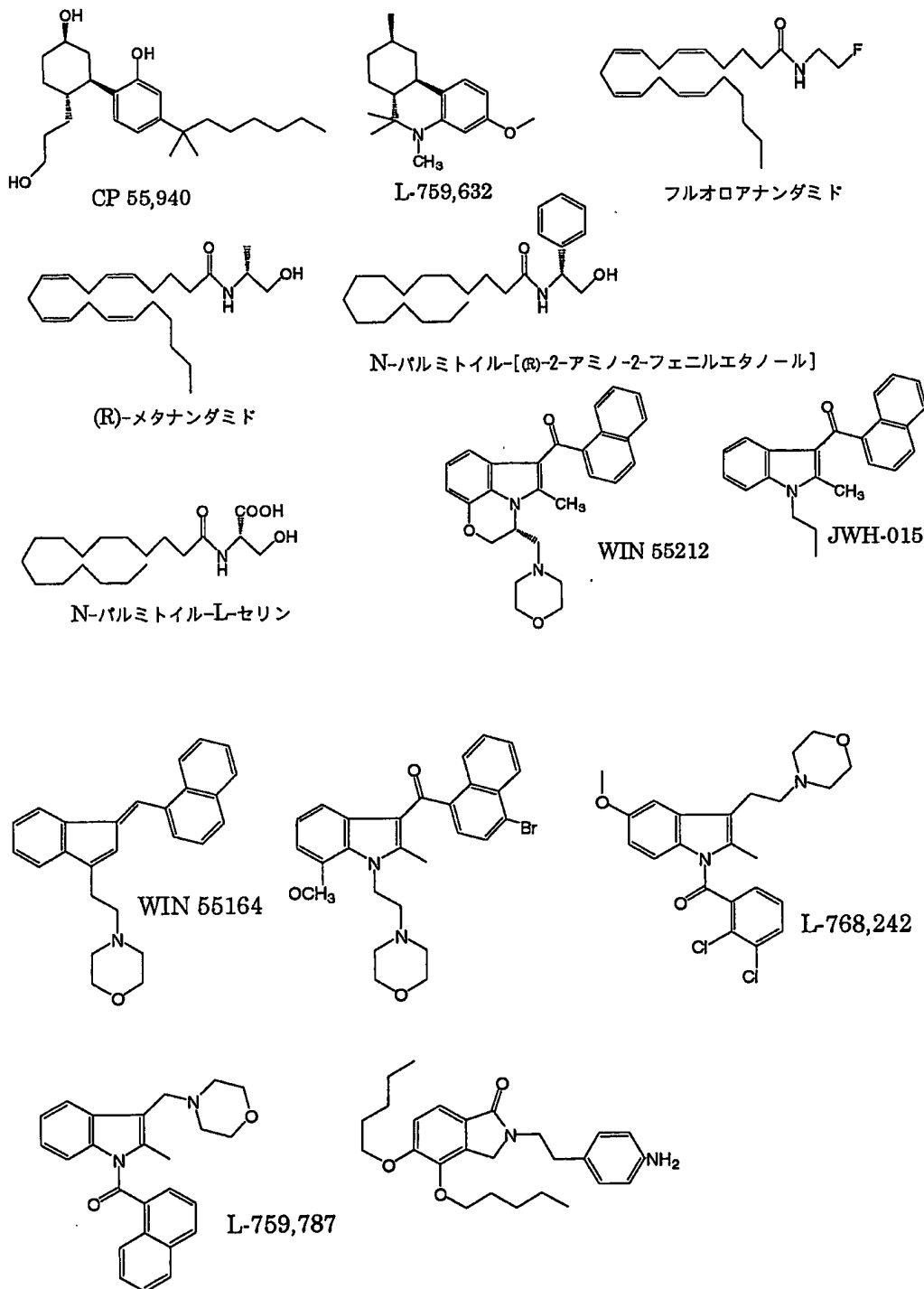
上記(1)～(11)記載の化合物は、カンナビノイド受容体親和性作用を有
する化合物であるが、その多くはカンナビノイド受容体アゴニスト作用を示し、
15 特にカンナビノイド2型受容体に対して、強力なアゴニスト作用を発揮する。ま
た、これらの化合物の中には、カンナビノイド1型受容体に対してもアゴニスト
作用を示すものもあり、このような化合物は両方のタイプのカンナビノイド受容
体に対して、アゴニスト作用を発揮することができ、強力な抗掻痒作用を発揮す
ることができる。なお、カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物は、
20 試験例2記載の方法により、選択することができる。すなわち、カンナビノイド
受容体を介して、フォルスコリン刺激によるcAMP生成反応を阻害することがで
きる化合物を選択すればよい。

上記(12)～(17)記載の化合物は、カンナビノイド1型受容体アゴニス
ト作用を有する化合物であり、その構造は、Current Medicinal Chemistry, 1999,
25 Vol.6, No.8, p636 に開示されている。



上記(18)～(20)のいずれかに記載の化合物も、カンナビノイド受容体
アゴニスト作用を有する化合物であり、本発明の抗掻痒剤に使用することができ
る。具体的には、以下の化合物が挙げられる。





上記(21)～(25)のいずれかに記載の化合物も、カンナビノイド受容体
 5 アゴニスト作用を有する化合物であり、本発明の抗搔痒剤に使用することができる。

以下に各用語の意味を説明する。各用語は本明細書中、統一した意味で使用し、単独で又は他の用語と一緒にあって、同一の意味を有する。

「アルキレン」とは、炭素数 1 ～ 10 の直鎖状又は分枝状のアルキレンを意味し、例えば、メチレン、エチレン、1-メチルエチレン、1-エチルエチレン、
 5 1, 1-ジメチルエチレン、1, 2-ジメチルエチレン、1, 1-ジエチルエチレン、1, 2-ジエチルエチレン、1-エチル-2-メチルエチレン、トリメチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、1, 1-ジメチルトリメチレン、1, 2-ジメチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、2-エチルトリメチレン、1, 1-ジエチルトリメチレン、1, 2-ジエチルトリメチレン、2, 2-ジエチルトリメチレン、2-エチル-2-メチルトリメチレン、テトラメチレン、1-メチルテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、1, 1-ジメチルテトラメチレン、1, 2-ジメチルテトラメチレン、2, 2-ジメチルテトラメチレン、2, 2-ジ-*n*-プロピルトリメチレン等が挙げられる。

15 R^1 のアルキレンとしては、炭素数 2 ～ 9 の直鎖状又は分枝状のアルキレン、さらには、炭素数 2 ～ 9 の分枝状のアルキレンが好ましい。具体的には、2, 2-ジメチルトリメチレン、2, 2-ジエチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、トリメチレン、2, 2-ジ-*n*-プロピルトリメチレン、2, 2-ジ-イソプロピルトリメチレン、1, 1-ジメチルエチレン、
 20 又は 1-メチルエチレンが好ましい。これらの位置番号は、 $N-R^1-S$ の順に付した場合と、 $S-R^1-N$ の順に付した場合の両方を意味する。

Y^1 、 Y^3 、 Y^5 、 Y^6 及び E のアルキレンとしては、炭素数 1 ～ 4 のアルキレンが好ましい。

「置換されていてもよいアルキレン」の置換基としては、アルキレン（例えば、
 25 メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン等）、シクロアルキル（例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等）、アルコキシ（例えば、メトキシ、エトキシ等）、アルキルチオ

(例えば、メチルチオ、エチルチオ等)、アルキルアミノ(例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ等)、アシルアミノ(例えば、アセチルアミノ等)、アリール(例えば、フェニル等)、アリーロキシ(例えば、フェノキシ等)、ハロゲン(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、アルキルスルホニル(例えば、メタンスルホニル、エタンスルホニル等)、アリールスルホニル(例えば、ベンゼンスルホニル等)、シアノ、ヒドロキシアミノ、カルボキシ、アルコキシカルボニル(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等)、アシル(例えば、アセチル、ベンゾイル等)、アラキル(例えば、ベンジル等)、メルカプト、ヒドラジノ、アミジノ、グアニジノ等が挙げられ、これらの置換基は1～4個の任意の位置で置換していてもよい。R¹の「置換されていてもよいアルキレン」の置換基としては、特に、アルキレンが好ましい。

なお、アルキレンで置換されたアルキレンには、スピロ原子を介してアルキレンで置換されたアルキレン(例えば、2,2-エチレントリメチレン、2,2-トリメチレントリメチレン、2,2-テトラメチレントリメチレン、2,2-ペンタメチレントリメチレン等)、及び異なる位置がアルキレンで置換されたアルキレン(例えば、1,2-テトラメチレンエチレン、1,2-エチレントリメチレン等)が包含される。具体的には、2,2-エチレントリメチレン、2,2-トリメチレントリメチレン、2,2-テトラメチレントリメチレン、2,2-ペンタメチレントリメチレンが好ましく、特に、2,2-エチレントリメチレン、2,2-テトラメチレントリメチレン、2,2-ペンタメチレントリメチレンが好ましい。

「アルキル」とは、炭素数1～10の直鎖状又は分枝状のアルキルを意味し、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、sec-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、i-ペンチル、neo-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デシルな

どが挙げられる。特に、炭素数 1～4 の直鎖又は分枝状のアルキルが好ましく、
具体的には、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-
ブチル、sec-ブチル、t-ブチルが好ましい。

「アルコキシ」のアルキル部分は、上記「アルキル」と同意義であり、「アル
5 コキシ」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポ
キシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、sec-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペ
ンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、n-ヘプチルオキシ、n-オクチルオキシ
などが挙げられる。特に、炭素数 1～4 の直鎖又は分枝状のアルコキシが好まし
く、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-
10 -ブトキシ、sec-ブトキシ、t-ブトキシが好ましい。

「アルキルチオ」のアルキル部分は、上記「アルキル」と同意義であり、「ア
ルキルチオ」としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、
i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、sec-ブチルチオ、t-
ブチルチオ、n-ペンチルチオ、n-ヘキシルチオ等が挙げられる。特に、炭
15 素数 1～4 の直鎖又は分枝状のアルキルチオが好ましく、メチルチオ、エチルチ
オ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、
sec-ブチルチオ、t-ブチルチオが好ましい。

「置換されていてもよいアミノ」としては、非置換アミノ、アルキルアミノ（例
えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、i-プロピルアミノ、
20 ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、エチルメチルアミノ、プロピルメチルアミノ）、
アシルアミノ（例えば、アセチルアミノ、ホルミルアミノ、プロピオニルアミノ、
ベンゾイルアミノ）、アシルアルキルアミノ（例えば、N-アセチルメチルアミ
ノ）、アラキルアミノ（例えば、ベンジルアミノ、1-フェニルエチルアミノ、
2-フェニルエチルアミノ、1-フェニルプロピルアミノ、2-フェニルプロピ
25 ルアミノ、3-フェニルプロピルアミノ、1-ナフチルメチルアミノ、2-ナフ
チルメチルアミノ、ジベンジルアミノ等）、アルキルスルホニルアミノ（例えば、
メタンスルホニルアミノ、エタンスルホニルアミノ等）、アルケニルオキシカル

ボニルアミノ（例えば、ビニルオキシカルボニルアミノ、アリルオキシカルボニルアミノ等）、アルコキシカルボニルアミノ（例えば、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、tert-ブトキシカルボニルアミノ等）、アルケニルアミノ（例えば、ビニルアミノ、アリルアミノ等）、アリーールカルボニルアミノ（例えば、ベンゾイルアミノ等）、ヘテロアリーールカルボニルアミノ（例えば、ピリジンカルボニルアミノ等）が挙げられる。

「アリーール」とは、炭素数6～14の芳香族炭素環式基を意味し、例えば、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントリル等が挙げられる。

10 「アラルキル」とは、上記「アルキル」に上記「アリーール」が置換した基を意味し、例えば、ベンジル、フェニルエチル（例えば、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル）、フェニルプロピル（例えば、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル等）、ナフチルメチル（例えば、1-ナフチルメチル、2-ナフチルメチル等）等が挙げられる。

15 「アラルキルオキシ」のアラルキル部分は、上記「アラルキル」と同意義であり、「アラルキルオキシ」としては、例えば、ベンジルオキシ、フェニルエチルオキシ（例えば、1-フェニルエチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ）、フェニルプロピルオキシ（例えば、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ等）、ナフチルメトキシ（例えば、1-ナフチルメトキシ、2-ナフチルメトキシ等）等が挙げられる。

20 「アラルキルチオ」のアラルキル部分は、上記「アラルキル」と同意義であり、「アラルキルチオ」としては、例えば、ベンジルチオ、フェニルエチルチオ（例えば、1-フェニルエチルチオ、2-フェニルエチルチオ）、フェニルプロピルチオ（例えば、1-フェニルプロピルチオ、2-フェニルプロピルチオ、3-フェニルプロピルチオ等）、ナフチルメチルチオ（例えば、1-ナフチルメチルチオ、2-ナフチルメチルチオ等）等が挙げられる。

「アラルキルアミノ」とは、上記「アラルキル」が1又は2個置換したアミノ

を意味し、例えば、ベンジルアミノ、フェニルエチルアミノ（例えば、1-フェニルエチルアミノ、2-フェニルエチルアミノ）、フェニルプロピルアミノ（例えば、1-フェニルプロピルアミノ、2-フェニルプロピルアミノ、3-フェニルプロピルアミノ）、ナフチルメチルアミノ（例えば、1-ナフチルメチルアミノ、2-ナフチルメチルアミノ等）、ジベンジルアミノ等が挙げられる。

「アルコキシアルキル」とは、上記「アルコキシ」で置換された上記「アルキル」を意味し、例えば、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、1-メトキシエチル、2-メトキシエチル、1-エトキシエチル、2-エトキシエチル、1-n-プロポキシエチル、2-n-プロポキシエチル、1-メトキシ-n-プロピル、2-メトキシ-n-プロピル、3-メトキシ-n-プロピル、1-エトキシ-n-プロピル、2-エトキシ-n-プロピル、3-エトキシ-n-プロピル、1-n-プロポキシ-n-プロピル、2-n-プロポキシ-n-プロピル、3-n-プロポキシ-n-プロピル等が挙げられる。

「アルキルチオアルキル」とは、上記「アルキルチオ」で置換された上記「アルキル」を意味し、例えば、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、1-メチルチオエチル、2-メチルチオエチル、1-エチルチオエチル、2-エチルチオエチル、1-n-プロピルチオエチル、2-n-プロピルチオエチル、3-n-プロピルチオエチル、1-メチルチオ-n-プロピル、2-メチルチオ-n-プロピル、3-メチルチオ-n-プロピル、1-エチルチオ-n-プロピル、2-エチルチオ-n-プロピル、3-エチルチオ-n-プロピル、1-n-プロピルチオ-n-プロピル、2-n-プロピルチオ-n-プロピル、3-n-プロピルチオ-n-プロピル等が挙げられる。

「置換されていてもよいアミノアルキル」とは、上記「置換されていてもよいアミノ」で置換された上記「アルキル」を意味し、例えば、N-メチルアミノメチル、N-アセチルアミノメチル、N,N-ジメチルアミノメチルなどが挙げられる。

「芳香族複素環式基」とは、窒素原子、酸素原子、および／又は硫黄原子を 1 ～ 4 個含む炭素数 1 ～ 9 の芳香族複素環式基を意味し、例えば、フリル（例えば、2-フリル、3-フリル）、チエニル（例えば、2-チエニル、3-チエニル）、ピロリル（例えば、1-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル）、イミダゾリル（例えば、1-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル）、ピラゾリル（例えば、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル）、トリアゾリル（例えば、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1, 2, 4-トリアゾール-4-イル）、テトラゾリル（例えば、1-テトラゾリル、2-テトラゾリル、5-テトラゾリル）、オキサゾリル（例えば、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-オキサゾリル）、イソキサゾリル（例えば、3-イソキサゾリル、4-イソキサゾリル、5-イソキサゾリル）、チアゾリル（例えば、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル）、チアジアゾリル、イソチアゾリル（例えば、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル）、ピリジル（例えば、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル）、ピリダジニル（例えば、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル）、ピリミジニル（例えば、2-ピリミジニル、4-ピリミジニル、5-ピリミジニル）、フラザニル（例えば、3-フラザニル）、ピラジニル（例えば、2-ピラジニル）、オキサジアゾリル（例えば、1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル）、ベンゾフリル（例えば、2-ベンゾ[b]フリル、3-ベンゾ[b]フリル、4-ベンゾ[b]フリル、5-ベンゾ[b]フリル、6-ベンゾ[b]フリル、7-ベンゾ[b]フリル）、ベンゾチエニル（例えば、2-ベンゾ[b]チエニル、3-ベンゾ[b]チエニル、4-ベンゾ[b]チエニル、5-ベンゾ[b]チエニル、6-ベンゾ[b]チエニル、7-ベンゾ[b]チエニル）、ベンズイミダゾリル（例えば、1-ベンズイミダゾリル、2-ベンズイミダゾリル、4-ベンズイミダゾリル、5-ベンズイミダゾリル）、ジベンゾフリル、ベンゾオキサゾリル、キノキサリル（例えば、2-キノキサリニル、5-キノキサリニル、6-キノキサリニル）、シンノリニル（例えば、3-シンノリニル、4-シンノリニル、5-シンノリニル、6-シンノリニル、7-シンノリニル、8-シンノリニル）、キナゾリル（例えば、2-キナゾリニル、4-キナゾリニル、5-キナゾリニル、6-キナゾリニル、7-キナゾリニル、8-キナゾリニル

ル)、キノリル(例えば、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリル)、フタラジニル(例えば、1-フタラジニル、5-フタラジニル、6-フタラジニル)、イソキノリル(例えば、1-イソキノリル、3-イソキノリル、4-イソキノリル、5-イソキノリル、6-イソキノリル、7-イソキノリル、8-イソキノリル)、プリル、プテリジニル(例えば、2-プテリジニル、4-プテリジニル、6-プテリジニル、7-プテリジニル)、カルバゾリル、フェナントリジニル、アクリジニル(例えば、1-アクリジニル、2-アクリジニル、3-アクリジニル、4-アクリジニル、9-アクリジニル)、インドリル(例えば、1-インドリル、2-インドリル、3-インドリル、4-インドリル、5-インドリル、6-インドリル、7-インドリル)、イソインドリル、ファナジニル(例えば、1-フェナジニル、2-フェナジニル)またはフェノチアジニル(例えば、1-フェノチアジニル、2-フェノチアジニル、3-フェノチアジニル、4-フェノチアジニル)等が挙げられる。

R⁶の芳香族複素環式基としては、特に、2-チエニルが好ましい。

Aの芳香族複素環式基としては、特に、ピリジル、キノリニル、イソキノリニルが好ましい。

「複素環式基」とは、環の構成原子として窒素原子、酸素原子及び／又は硫黄原子を1～4個含む炭素数1～14の単環又は2～3個の縮合環から誘導される基を意味し、例えば上記「芳香族複素環式基」及び下記「非芳香族複素環式基」を包含する。

「非芳香族複素環式基」とは、窒素原子、酸素原子、および／又は硫黄原子を1～4個含む炭素数1～9の非芳香環を意味し、例えば、1-ピロリニル、2-ピロリニル、3-ピロリニル、ピロリジノ、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、1-イミダゾリニル、2-イミダゾリニル、4-イミダゾリニル、1-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、1-ピラゾリニル、3-ピラゾリニル、4-ピラゾリニル、1-ピラゾリジニル、3-ピラゾリジニル、4-ピラゾリジニル、ピペリジノ、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、ピペラジノ、2-ピペラジニル、2-モルホリニル、3-モルホリニル、モルホリノ、テトラヒドロピラニル等が挙げられる。

特に、モルホリノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノが好ましい。

「アルケニル」とは、上記「アルキル」に1個又はそれ以上の二重結合を有する炭素数2～8個の直鎖状又は分枝状のアルケニルを意味し、例えば、ビニル、
5 1-プロペニル、アリル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、
2-ペンテニル、1,3-ブタジエニル、3-メチル-2-ブテニル等が挙げられる。

「アルキニル」とは、上記「アルキル」に1個又はそれ以上の三重結合を有する炭素数2～8個の直鎖状又は分枝状のアルキニルを意味し、例えば、エチニル等が挙げられる。

10 「シクロアルキル」は、炭素数3～10の環状飽和炭化水素基を意味し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル等が挙げられる。好ましくは、炭素数3～6のシクロアルキルであり、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルが挙げられる。

15 「ヘテロ原子を含んでもよいアルキレン」とは、1～3個のヘテロ原子を含んでもよい炭素数2～10の直鎖状又は分枝状のアルキレンを意味し、例えば、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、エチレンオキシエチレン等が挙げられる。特に、1
20 個のヘテロ原子を含んでもよい炭素数3又は5直鎖状のアルキレンが好ましく、
テトラメチレン、ペンタメチレン、エチレンオキシエチレン、エチレンアミノエチレン、エチレンチオエチレンが挙げられる。

「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素を意味する。特に、フッ素、塩素、臭素が好ましい。

25 「アシル」とは、水素以外の基が置換したカルボニル基を意味し、例えば、アルキルカルボニル（例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、オクタノイル、ラウロイ

ル等)、アルケニルカルボニル(例えば、アクリロイル、メタアクリロイル)、シクロアルキルカルボニル(例えば、シクロプロパンカルボニル、シクロブタンカルボニル、シクロペンタンカルボニル、シクロヘキサンカルボニル等)、アリールカルボニル(ベンゾイル、ナフトイル等)、ヘテロアリールカルボニル(ピリジルカルボニル等)が挙げられる。これらの基はさらにアルキル、ハロゲン等の置換基で置換されていてもよい。例えば、アルキルが置換したアリールカルボニルとしてはトルオイル基、ハロゲンが置換したアルキルカルボニル基としてはトリフルオロアセチル基等が挙げられる。

「アルコキシカルボニル」とは、カルボニルに上記「アルコキシ」が置換した基を意味し、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、*i*-プロポキシカルボニル、*n*-ブトキシカルボニル、*i*-ブトキシカルボニル、*sec*-ブトキシカルボニル、*tert*-ブトキシカルボニル、*n*-ペンチルオキシカルボニル、*n*-ヘキシルオキシカルボニル、*n*-ヘプチルオキシカルボニル、*n*-オクチルオキシカルボニル等が挙げられる。特に、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等が好ましい。

「置換されていてもよいカルバモイル」の置換基としては、アルキル(例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル等)、アシル(例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ベンゾイル等)等が挙げられる。カルバモイル基の窒素原子が、これらの置換基でモノ置換またはジ置換されていてもよい。「置換されていてもよいカルバモイル」としては、カルバモイル、*N*-メチルカルバモイル、*N*-エチルカルバモイル等が好ましい。

「アルケニルオキシ」のアルケニル部分は、上記「アルケニル」と同意義であり、「アルケニルオキシ」としては、例えば、ビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、1,3-ブタジエニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ等が挙げられる。

「アルキニルオキシ」のアルキニル部分は、上記「アルキニル」と同意義であり、「アルキニルオキシ」としては、例えば、エチニルオキシ、1-プロピニルオ

キシ、2-プロピニルオキシ、1-ブチニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ等が挙げられる。

「アルキルスルフィニル」のアルキル部分は、上記「アルキル」と同意義であり、「アルキルスルフィニル」としては、例えば、メタンスルフィニル、エタンスルフィニル等が挙げられる。

「アルキルスルホニル」のアルキル部分は、上記「アルキル」と同意義であり、「アルキルスルホニル」としては、例えば、メタンスルホニル、エタンスルホニル等が挙げられる。

「炭素環式基」とは、炭素原子及び水素原子で構成される環状の置換基を意味し、環状部分は飽和環であっても不飽和環であってもよい。例えば、上記「アリーール」、上記「シクロアルキル」、下記「シクロアルケニル」等が挙げられる。なお、炭素数 3 ～ 14 の環から誘導される基が好ましい。

「シクロアルケニル」とは、上記「シクロアルキル」に 1 個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数 3 ～ 12 個のアルケニル基を意味し、例えば、シクロプロベニル（例えば、1-シクロプロベニル）、シクロブテニル（例えば、1-シクロブテニル）、シクロペンテニル（例えば、1-シクロペンテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル）、シクロヘキセニル（例えば、1-シクロヘキセン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル）、シクロヘプテニル（例えば、1-シクロヘプテニル）、シクロオクテニル（例えば、1-シクロオクテニル）等が挙げられる。特に、1-シクロヘキセン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イルが好ましい。

「アルケニレン」は、上記「アルキレン」に 1 個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数 2 ～ 12 個の直鎖状または分枝状のアルケニレン基を意味し、例えば、ビニレン、プロベニレンまたはブテニレンが挙げられる。好ましくは、炭素数 2 ～ 6 個の直鎖状のアルケニレン基であり、ビニレン、プロベニレン、ブテニレン、ペンテニレン、ヘキセニレン、ブタジエニレン等である。

「アルキニレン」とは、上記「アルキレン」に1個またはそれ以上の二重結合を有する炭素数2～12個の直鎖状または分枝状のアルケニレン基を意味する。

- 「置換されていてもよいアルキレン」、「置換されていてもよいアララルキルオキシ」、「置換されていてもよいアララルキルチオ」、「置換されていてもよいアララルキルアミノ」、「置換されていてもよいアリール」、「置換されていてもよい芳香族複素環式基」、「置換されていてもよい複素環式基」、「置換されていてもよいアルキル」、「置換されていてもよいアルケニル」、「置換されていてもよいアルキニル」、「置換されていてもよいアルコキシアルキル」、「置換されていてもよいシクロアルキル」、「置換されていてもよい炭素環式基」、「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル」、「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環」が置換基を有する場合、それぞれ同一または異なる1～4個の置換基で任意の位置が置換されていてもよい。
- 置換基としては、例えば、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン（フッ素、塩素、臭素、ヨウ素）、ハロアルキル（例えば、 CF_3 、 CH_2CF_3 、 CH_2CCl_3 等）、ハロアルコキシ、アルキル（例えば、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル等）、アルケニル（例えば、ビニル）、ホルミル、アシル（例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、ピバロイル、ベンゾイル、ピリジンカルボニル、シクロペンタンカルボニル、シクロヘキサニルカルボニル等）、アルキニル（例えば、エチニル）、シクロアルキル（例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等）、シクロアルケニル（例えば、シクロプロベニル等）、アルコキシ（例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ等）、アルコキシカルボニル（例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル等）、ニトロ、ニトロソ、オキソ、置換されていてもよいアミノ（例えば、アミノ、アルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ等）、ホルミルアミノ、アシルアミノ（例えば、アセチルアミノ、

ベンゾイルアミノ等)、アラルキルアミノ(例えば、ベンジルアミノ、トリチルアミノ)、ヒドロキシアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アルケニルオキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルケニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、ヘテロアリールカルボニルアミノ等)、アジド、アリール(例えば、フェニル等)、アリールオキシ(例えば、フェノキシ)、アラルキル(例えば、ベンジル、フェネチル、フェニルプロピル等)、アルキレンジオキシ(例えば、メチレンジオキシ)、アルキレン(例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン等)、アルケニレン(例えば、プロペニレン、ブテニレン、ブタジエニレン等)、シアノ、イソシアノ、イソシアナト、チオシアナト、イソチオシアナト、メルカプト、アルキルチオ(例えば、メチルチオ、エチルチオ等)、アルキルスルホニル(例えば、メタンスルホニル、エタンスルホニル)、アリールスルホニル(例えば、ベンゼンスルホニル等)、置換されていてもよいカルバモイル、スルファモイル、ホルミルオキシ、ハロホルミル、オキザロ、メルカプト、チオホルミル、チオカルボキシ、ジチオカルボキシ、チオカルバモイル、スルフィノ、スルフォ、スルホアミノ、ヒドラジノ、ウレイド、アミジノ、グアニジノ、アルキルスルホニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、ハロアルコキシカルボニルオキシ、ホルミルオキシ、アシルチオ、チオキソ、アルコキシアルコキシ、アルキルチオアルコキシ等が挙げられる。

20 「ハロアルキル」とは、上記「アルキル」に1以上のハロゲンが置換した基を意味し、例えば、クロロメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル(例えば、1-クロロエチル、2-クロロエチル等)、ジクロロエチル(例えば、1, 1-ジクロロエチル、1, 2-ジクロロエチル、2, 2-ジクロロエチル等)等が挙げられる。

25 「ハロアルコキシ」とは、上記「アルコキシ」に1以上のハロゲンが置換した基を意味し、例えば、ジクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ等)等が挙げられる。

げられる。

「アリールオキシ」とは、酸素原子に上記「アリール」が置換した基を意味し、例えば、フェノキシ、ナフトキシ（例えば、1-ナフトキシ、2-ナフトキシ等）、アントリルオキシ（例えば、1-アントリルオキシ、2-アントリルオキシ等）、
5 フェナントリルオキシ（例えば、1-フェナントリルオキシ、2-フェナントリルオキシ等）等が挙げられる。

「アルコキシアルコキシ」とは、上記「アルコキシ」で置換された上記「アルコキシ」を意味し、例えば、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、n-プロポキシメトキシ、イソプロポキシメトキシ、1-メトキシエトキシ、2-メトキシ
10 エトキシなどが挙げられる。

「アルキルチオアルコキシ」とは、上記「アルキルチオ」で置換された上記「アルコキシ」を意味し、例えば、メチルチオメトキシ、エチルチオメトキシ、n-プロピルチオメトキシ、イソプロピルチオメトキシ、1-メチルチオエトキシ、
2-メトキシエトキシなどが挙げられる。

15 R^aの「置換されていてもよい炭素環式基」としては、置換されていてもよいアリール（置換基としては、カルボキシ、置換されていてもよいアミノ、アルコキシ、アルキルチオ、アルキレンジオキシ、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン化アルキル及び／又はハロゲン化アルコキシ）、置換されていてもよいシクロアルキル（置換基としては、アリール及び／又はヒドロキシ）、置換されて
20 いてもよいシクロアルケニル（置換基としては、アルケニレン、ヒドロキシ、アルキルスルホニルオキシ、アジド、アミノ及び／又はアシルアミノ）が好ましい。

R^aの「置換されていてもよい複素環式基」としては、置換されていてもよい芳香族複素環式基（置換基としては、オキソ、ヘテロアリール、ハロゲン、アリー
25 ル及び／又はアルキル）又は置換されていてもよい非芳香族複素環式基（置換基としては、ハロゲンで置換されていてもよいアリール、アラルキル、アシル、アリールカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルキルスルホニル、アリー

ルスルホニル、アルキル及び／又はハロゲン化アルキルカルボニル)が好ましい。

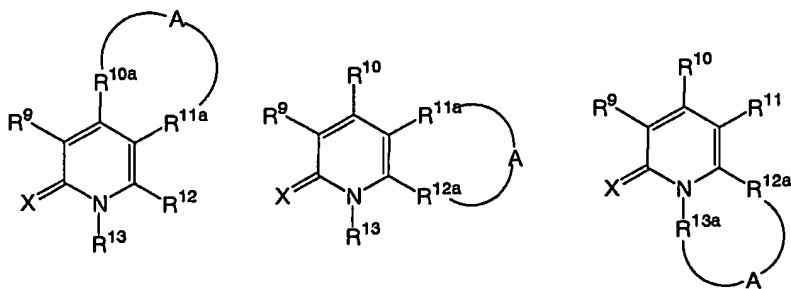
「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環」上の好ましい置換基としては、オキソ、ヒドロキシ、アルケニレン（例えば、プロペニレン、ブテニレン、ブタジエニレン）、アシル（例えば、アセチル、プロピオニル、ブチリル、ピバロイル、ベンゾイル、ピリジンカルボニル、シクロペンタンカルボニル、シクロヘキサンカルボニル等）、アラルキル（例えば、ベンジル等）、アルキレン（例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン等）等が挙げられる。

R^{13} の「ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよいアルキル」の置換基としては、ハロゲン、ヒドロキシ、アジド、アミノ、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アシルチオ、アシルアミノ、アリールカルボニルアミノ、シクロアルキルカルボニルアミノ、ハロゲン化アルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、ホルミル、オキソ又はシアノが好ましい。

15

式 (I) 又は (II) で示される化合物において、 m は0～2の整数を意味し、特に、 $m=0$ が好ましい。

式 (III) で示される化合物において、「 R^2 及び R^3 の組合わせ、 R^3 及び R^4 の組合わせ、 R^4 及び R^5 の組合わせのいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する」とは、具体的には以下に示す構造を意味する。



(式中、各記号は前記と同意義であり； $-R^{10a}-A-R^{11a}-$ 、 $-R^{11a}-A-$

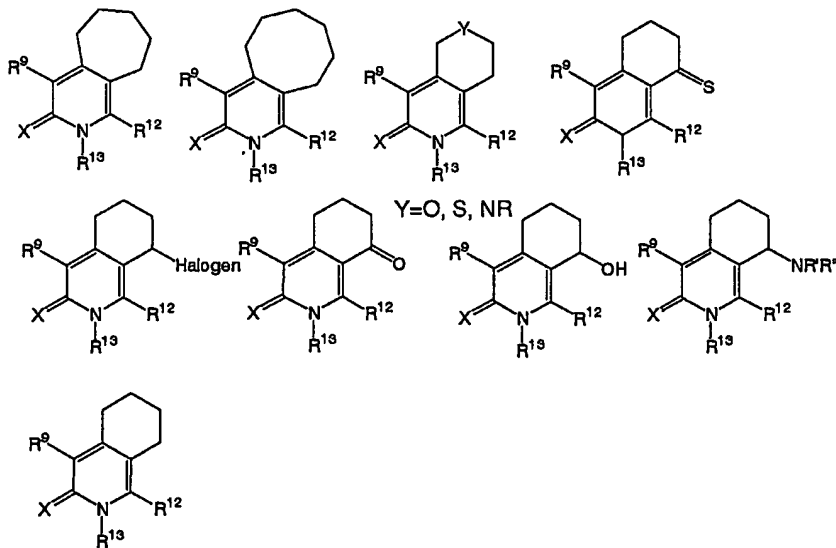
—R^{12a}—、—R^{12a}—A—R^{13a}—はそれぞれ独立してヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキレンである。）

特に、ピリドン環と結合している原子が炭素である場合、すなわちR^{10a}、R^{11a}、R^{12a}、R^{13a}が炭素原子である場合が好ましい。なお、この炭素原子にも上述の置換基（例えば、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、オキシ、ハロゲン、アミノ等）が結合していてもよい。

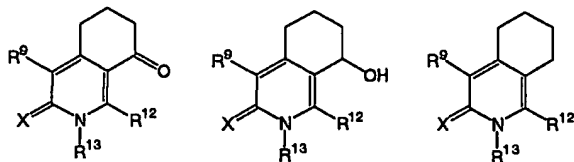
「環」は、4～12員の環を意味し、特に5～10員の環、さらには5～8員の環が好ましい。環を構成する原子としては、炭素原子、ヘテロ原子（窒素原子、硫黄原子、酸素原子）、水素原子等が挙げられる。

10

R¹⁰及びR¹¹が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合、例えば、以下の化合物が挙げられる。



15 特に好ましいのは下記の化合物である。



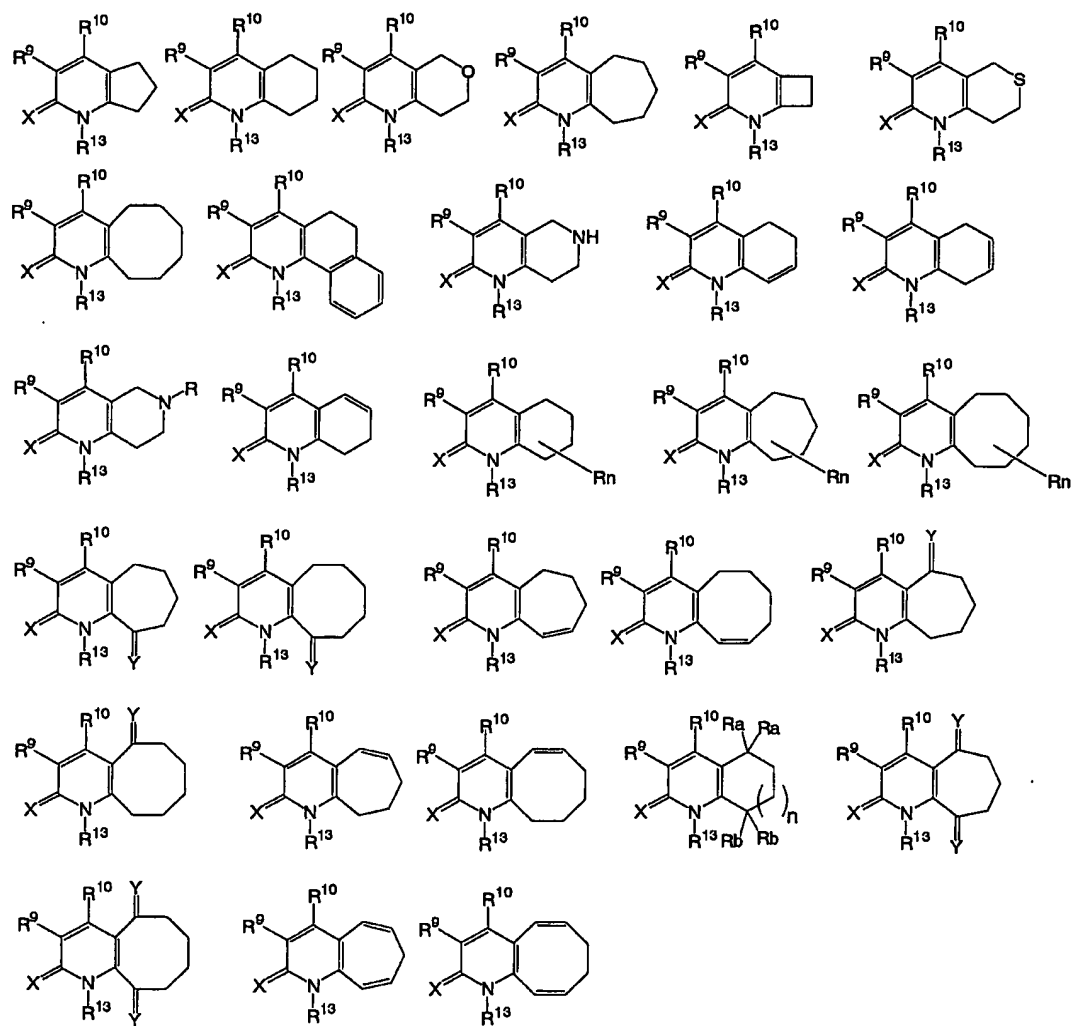
（各記号は前記と同意義；Yは酸素原子、硫黄原子又は—NR—；R、R'及び

R' ' は水素、アルキル、アラルキル等)

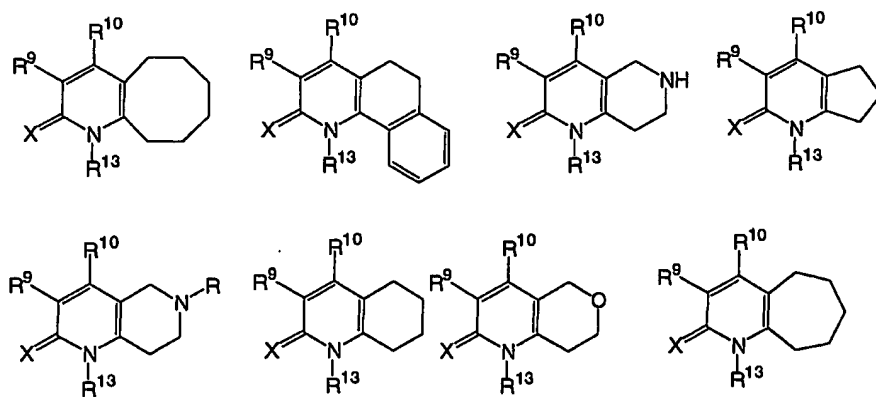
R^{1 1} 及び R^{1 2} が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子（特に、酸素原子、窒素原子）及び／又は不飽和結合（特に、二重結合）が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合、特に以下の化合物が好ましい。

- (1) 該環が非置換炭素環である場合、
- (2) 該環の異なる位置がアルケニレンで置換されている場合、
- (3) 該環が酸素原子又は窒素原子が介在した環である場合、
- (4) 該環が窒素原子が介在した環であり、該窒素原子が置換基（特にアルキル、アシル、アラルキル等）で置換されている場合、
- (5) 該環が非置換炭素環（但し、R^{1 1} が置換している炭素原子と R^{1 2} が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の炭素原子間の結合は単結合である）である場合、
- (6) 該環がヘテロ原子が介在した非置換の環（但し、R^{1 1} が置換している炭素原子と R^{1 2} が置換している炭素原子間の結合のみが二重結合であり、他の原子間の結合は単結合である）である場合。

例えば、以下の化合物が挙げられる。



特に好ましいのは下記の構造である。



(各記号は前記と同意義；Yは酸素原子又は硫黄原子；R、R_a及びR_bはアシ
5 ル、アラルキル、アルキル、アルコキシ、オキソ等；nは0～5の整数)

なお、本発明には R^{11} 及び R^{12} が一緒になって、隣接する原子と共に不飽和結合が介在した炭素環を形成する場合も包含される。この場合、不飽和結合としては二重結合が好ましく、 R^{11} が置換している炭素原子と R^{12} が置換している炭素原子間の二重結合以外に、さらに二重結合を有する場合が好ましい。

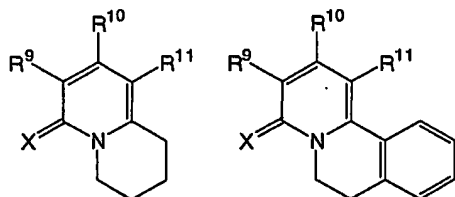
- 5 R^{11} 及び R^{12} が一緒になって、隣接する原子と共にベンゼン環を形成する場合も本発明に包含される。例えば、WO97/29079記載の化合物や、WO99/02499記載の化合物が挙げられる。

- 10 R^{12} 及び R^{13} が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子（特に、酸素原子、窒素原子）及び／又は不飽和結合（特に、二重結合）が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成する場合、特に以下の化合物が好ましい。

（１）該環が不飽和結合（特に、二重結合）が介在していてもよい置換されていてもよい炭素環である場合、

（２）該環が非置換の場合、

- 15 （３）該環の異なる位置が置換基（特に、アルケニレン等）で置換されている場合が好ましい。例えば、以下の化合物が挙げられる。



- 20 なお、 R^{10} 及び R^{11} の組合わせ、 R^{11} 及び R^{12} の組合わせ、 R^{12} 及び R^{13} の組合わせのうち、 R^{11} 及び R^{12} の組合わせがヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環である場合が好ましい。

本発明においては、カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物のみならず、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩、それらの溶媒和物を使用することができる。

プロドラッグとは、生理学的条件下でインビボにおいて薬学的に活性な本発明化合物となる化合物である。適当なプロドラッグ誘導体を選択する方法および製造する方法は、例えば Design of Prodrugs, Elsevier, Amsterdam 1985 に記載されている。

- 5 本発明に係る化合物のプロドラッグは、脱離基を導入することが可能な置換基（例えば、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ等）に、脱離基を導入して製造することができる。アミノ基のプロドラッグとしては、カルバメート体（例えば、メチルカルバメート、シクロプロピルメチルカルバメート、tert-ブチルカルバメート、ベンジルカルバメート等）、アミド体（例えば、ホルムアミド、アセタミド
- 10 等）、N-アルキル体（例えば、N-アリルアミン、N-メトキシメチルアミン等）等が挙げられる。ヒドロキシ基のプロドラッグとしては、エーテル体（メトキシメチルエーテル、メトキシエトキシメチルエーテル等）、エステル体（例えば、アセタート、ピバロエート、ベンゾエート等）等が挙げられる。

- 製薬上許容される塩としては、塩基性塩として、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；カルシウム塩、マグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩；アンモニウム塩；トリメチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩、エタノールアミン塩、ジエタノールアミン塩、トリエタノールアミン塩、プロカイン塩等の脂肪族アミン塩；N,N-ジベンジルエチレンジアミン等のアラルキルアミン塩；ピリジン塩、ピコリン塩、キノリン塩、イソキノリン
- 20 塩等のヘテロ環芳香族アミン塩；テトラメチルアンモニウム塩、テトラエチルアンモニウム塩、ベンジルトリメチルアンモニウム塩、ベンジルトリエチルアンモニウム塩、ベンジルトリブチルアンモニウム塩、メチルトリオクチルアンモニウム塩、テトラブチルアンモニウム塩等の第4級アンモニウム塩；アルギニン塩、リジン塩等の塩基性アミノ酸塩等が挙げられる。酸性塩としては、例えば、塩酸塩、
- 25 硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、炭酸塩、炭酸水素塩、過塩素酸塩等の無機酸塩；酢酸塩、プロピオン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩等の有機酸塩；メタンスルホン酸塩、イ

セチオン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩；アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩等の酸性アミノ酸等が挙げられる。

溶媒和物としては、本発明化合物、そのプロドラッグ又はそれらの製薬上許容される塩の溶媒和物を意味し、例えば、一溶媒和物、二溶媒和物、一水和物、二水和物等が挙げられる。

本発明に係る抗掻痒剤は、痒みを予防又は抑制するために使用されるものである。本発明に係る抗掻痒剤により、アレルギー反応または非アレルギー反応によって発現する痒みを抑制することができる。特に、本発明に係る抗掻痒剤は、抗原により誘発される痒みの治療剤として有用であり、具体的には、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー性結膜炎、アレルギー性鼻炎及び／又は接触性皮膚炎に由来する痒みの予防剤または治療剤として使用することができる。

更に、本発明に係る抗掻痒剤は、痒みに伴う行動、例えば、引っ掻き行動、殴打などにより、二次的に発生する疾患、例えば、白内障、網膜剥離、炎症、感染、睡眠障害などの予防剤または治療剤としても有効である。

なお、アレルギー反応とは、抗原特異的なIgEと抗原が反応して、肥満細胞、好塩基球などが活性化されて起こる反応および接触性皮膚炎などの遅延型アレルギー反応によって起こる反応を意味し、非アレルギー反応とは、IgE非依存的に、例えば、化学物質などにより肥満細胞、好塩基球などが活性化されて起こる反応を意味する。

本発明化合物を治療に用いるには、通常の経口又は非経口投与用の製剤として製剤化する。本発明化合物を含有する医薬組成物は、経口及び非経口投与のための剤形をとることができる。即ち、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤などの経口投与製剤、あるいは、静脈注射、筋肉注射、皮下注射などの注射用溶液又は懸濁液、吸入薬、点眼薬、点鼻薬、坐剤、もしくは軟膏剤などの経皮投与製剤などの非経口投与製剤とすることもできる。

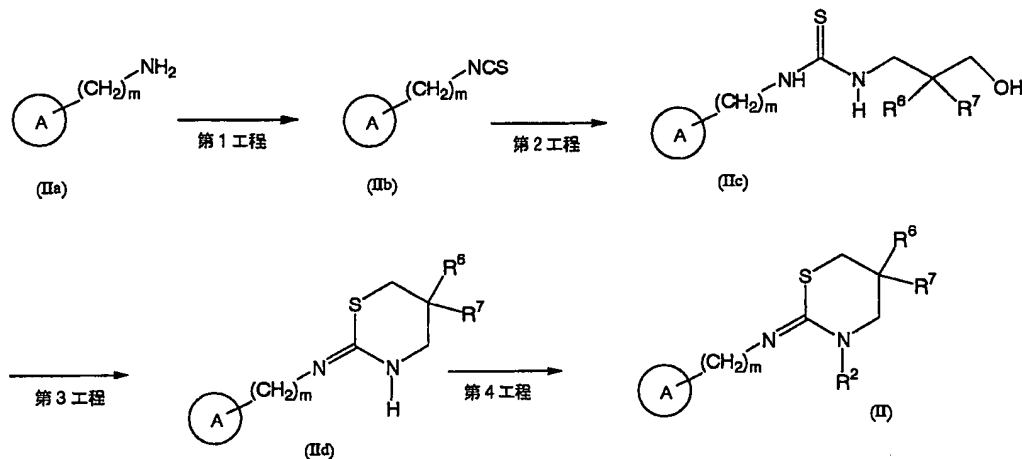
活性成分として使用する化合物のカンナビノイド受容体1型アゴニスト作用が弱く、カンナビノイド受容体2型アゴニスト作用が強い場合、いかなる製剤としても使用することができる。特に、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、シロップ剤などの経口投与製剤として使用することができる。なお、活性成分として使用する化合物のカンナビノイド受容体1型アゴニスト作用が強い場合は、局所的に投与することが好ましく、特に軟膏剤、クリーム、ローション等の製剤が好ましい。

これらの製剤は当業者既知の適当な担体、賦形剤、溶媒、基剤等を用いて製造することができる。例えば、錠剤の場合、活性成分と補助成分と一緒に圧縮又は成型する。補助成分としては、製剤的に許容される賦形剤、例えば結合剤（例えば、トウモロコシでん粉等）、充填剤（例えば、ラクトース、微結晶性セルロース等）、崩壊剤（例えば、でん粉グリコール酸ナトリウム等）又は滑沢剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム等）などが用いられる。錠剤は、適宜、コーティングしてもよい。シロップ剤、液剤、懸濁剤などの液体製剤の場合、例えば、懸濁化剤（例えば、メチルセルロース等）、乳化剤（例えば、レシチン等）、保存剤などを用いる。注射用製剤の場合、溶液、懸濁液又は油性もしくは水性乳濁液の形態のいずれでもよく、これらは懸濁安定剤又は分散剤などを含有していてもよい。吸入剤として使用する場合は吸入器に適応可能な液剤として、点眼剤として使用する場合も液剤又は懸濁化剤として用いる。

本発明化合物の投与量は、投与形態、患者の症状、年齢、体重、性別、あるいは併用される薬物（あるとすれば）などにより異なり、最終的には医師の判断に委ねられるが、経口投与の場合、体重1 kgあたり、1日0.01～100 mg、好ましくは0.01～10 mg、より好ましくは0.1～10 mg、非経口投与の場合、体重1 kgあたり、1日0.001～100 mg、好ましくは0.001～1 mg、より好ましくは0.01～1 mgを投与する。これを1～4回に分割して投与すればよい。

上記（1）又は（2）記載の化合物は、WO01/19807記載の製造法に従って製

造することができる。上記（３）～（５）のいずれかに記載の化合物は、以下の製造法に従って製造することができる。



（式中、各記号は前記と同意義）

5 第1工程

式（IIa）で示される化合物のアミノ基をイソチオシアン酸エステル（イソチオシアナート）に変換し、式（IIb）で示される化合物を製造する工程である。

- アミノ基からイソチオシアン酸エステル（イソチオシアナート）への変換法としては、（１）アンモニア（ NH_3 、 NH_4OH ）やトリエチルアミン（ Et_3N ）などの塩基の存在下に二硫化炭素（ CS_2 ）を作用させて得られるジチオカルバミド酸塩を、クロロ炭酸エチル（ $ClCO_2Et$ ）、トリエチルアミン（ Et_3N ）で処理する方法、（２）前記ジチオカルバミド酸塩を、硝酸鉛等の金属塩で処理する方法、（３）チオホスゲン（ $CSCl_2$ ）を作用させる方法、（４）チオカルボニルジイミダゾールを作用させる方法等が挙げられる。

- （１）の場合、塩基（１．０～１．５当量）及び二硫化炭素（１．０～１．５当量）を化合物（IIa）に加え、非プロトン性溶媒（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、 N,N -ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム等）中で０．５時間～１０時間攪拌する。その後、クロロ炭酸エチル（１．０～１．５当量）及びトリエチルアミン（１．０～１．５当量）を加え、非プロトン性溶媒（例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフ

ラン、N,N-ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム等) 中で0.5時間～10時間攪拌する。反応温度としては0℃～100℃が好ましく、特に0℃～室温が好ましい。

(3) の場合、チオホスゲン(1.0～1.5当量)を化合物(IIa)に加え、
5 非プロトン性溶媒(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム等) 中で0.5時間～10時間攪拌する。反応温度としては0℃～100℃が好ましく、特に0℃～室温が好ましい。

(4) の場合、チオカルボニルジイミダゾール(1.0～1.5当量)を化合物(IIa)に加え、非プロトン性溶媒(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロ
10 フラン、N,N-ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム等) 中で0.5時間～10時間攪拌する。反応温度としては0℃～100℃が好ましく、特に0℃～室温が好ましい。

式(IIa)で示される化合物としては、 $m=0$ の例として、アニリン、2-メチル
15 アニリン、2-エチルアニリン、2-n-プロピルアニリン、2-イソプロピルアニリン、2-n-ブチルアニリン、2-sec-ブチルアニリン、2-t-ブチルアニリン、3-メチルアニリン、3-イソプロピルアニリン、3-イソプロピル-4-メチルアニリン、3-t-ブチルアニリン、4-メチルアニリン、4-イソプロピルアニリン、2,6-ジメチルアニリン、2,3-ジメチルアニリン、2,4-ジメチルアニリン、3,4-ジエチルアニリン、2,5-ジメチル
20 アニリン、3,4-ジメチルアニリン、3,5-ジメチルアニリン、2,6-ジエチルアニリン、2,6-ジ-イソプロピルアニリン、2-メトキシアニリン、2-エトキシアニリン、2-イソプロポキシアニリン、3-メトキシアニリン、3,5-ジメトキシアニリン、3-n-ブトキシアニリン、4-n-ブトキシアニリン、4-エトキシアニリン、3,4-ジメトキシアニリン、2-メチルチオアニリン、2-エチルチオアニリン、2-イソプロピルチオアニ
25 リン、2-N,N-ジメチルアミノアニリン、2-フェニルアニリン、3-フェニルアニリン、4-フェノキシアニリン、2-シクロヘキシルアニリン、2-シクロペンチルアニリン、2-ニトロアニリン、2,4-ジニトロアニリン、2-フルオロアニリン、2-クロロ

アニリン、4-クロロアニリン、2,3-ジクロロアニリン、3,4-ジクロロアニリン、2-
イソプロピル-4-ニトロアニリン、2-イソプロピル-6-ニトロアニリン、2-ヒドロキ
シアニリン、2-N,N-ジメチルアミノカルボニルアニリン、2-N-アセチルアニリ
ン、2-(1-エチルプロピル)アニリン、2-イソプロピル 4-メチルアニリン、2-イ
5 ソプロピル-4-ヒドロキシアニリン、2-イソプロピル-4-クロロアニリン、2-イソプ
ロピル-4-アミノアニリン、2-イソプロピル-5-メチルアニリン、2-イソプロピル-5-
ヒドロキシアニリン、2-イソプロピル-5-クロロアニリン、4-クロロ-3-メチルアニ
リン、3,4-メチレンジオキシアニリン等が挙げられる。

m=1 の例としては、ベンジルアミン、2-メチルベンジルアミン、2-エチルベン
10 ジルアミン、2-n-プロピルベンジルアミン、2-イソプロピルベンジルアミン、2-n-
ブチルベンジルアミン、2-sec-ブチルベンジルアミン、2-t-ブチルベンジルアミン、
3-メチルベンジルアミン、3-イソプロピルベンジルアミン、3-イソプロピル-4-メ
チルベンジルアミン、3-t-ブチルベンジルアミン、4-メチルベンジルアミン、4-
イソプロピルベンジルアミン、2,6-ジメチルベンジルアミン、2,3-ジメチルベンジ
15 ルアミン、2,4-ジメチルベンジルアミン、3,4-ジエチルベンジルアミン、2,5-ジメ
チルベンジルアミン、3,4-ジメチルベンジルアミン、3,5-ジメチルベンジルアミン、
2,6-ジエチルベンジルアミン、2,6-ジ-イソプロピルベンジルアミン、2-メトキシベ
ンジルアミン、2-エトキシベンジルアミン、2-イソプロポキシベンジルアミン、
3-メトキシベンジルアミン、3,5-ジメトキシベンジルアミン、3-n-ブトキシベンジ
20 ルアミン、4-n-ブトキシベンジルアミン、4-エトキシベンジルアミン、3,4-ジメト
キシベンジルアミン、2-メチルチオベンジルアミン、2-エチルチオベンジルアミ
ン、2-イソプロピルチオベンジルアミン、2-N,N-ジメチルアミノベンジルアミン、
2-フェニルベンジルアミン、3-フェニルベンジルアミン、4-フェノキシベンジル
アミン、2-シクロヘキシルベンジルアミン、2-シクロペンチルベンジルアミン、
25 2-ニトロベンジルアミン、2,4-ジニトロベンジルアミン、2-フルオロベンジルアミ
ン、2-クロロベンジルアミン、4-クロロベンジルアミン、2,3-ジクロロベンジルア
ミン、3,4-ジクロロベンジルアミン、2-イソプロピル-4-ニトロベンジルアミン、

2-イソプロピル-6-ニトロベンジルアミン、2-ヒドロキシベンジルアミン、2-N,N-ジメチルアミノカルボニルベンジルアミン、2-N-アセチルベンジルアミン、2-(1-エチルプロピル)ベンジルアミン、2-イソプロピル-4-メチルベンジルアミン、2-イソプロピル-4-ヒドロキシベンジルアミン、2-イソプロピル-4-クロロベンジルアミン、2-イソプロピル-4-アミノベンジルアミン、2-イソプロピル-5-メチルベンジルアミン、2-イソプロピル-5-ヒドロキシベンジルアミン、2-イソプロピル-5-クロロベンジルアミン、4-クロロ-3-メチルベンジルアミン、3,4-メチレンジオキシベンジルアミン等が挙げられる。

m=2 の例としては、フェネチルアミン、2-メチルフェネチルアミン、2-エチルフェネチルアミン、2-n-プロピルフェネチルアミン、2-イソプロピルフェネチルアミン、2-n-ブチルフェネチルアミン、2-sec-ブチルフェネチルアミン、2-t-ブチルフェネチルアミン、3-メチルフェネチルアミン、3-イソプロピルフェネチルアミン、3-イソプロピル-4-メチルフェネチルアミン、3-t-ブチルフェネチルアミン、4-メチルフェネチルアミン、4-イソプロピルフェネチルアミン、2,6-ジメチルフェネチルアミン、2,3-ジメチルフェネチルアミン、2,4-ジメチルフェネチルアミン、3,4-ジエチルフェネチルアミン、2,5-ジメチルフェネチルアミン、3,4-ジメチルフェネチルアミン、3,5-ジメチルフェネチルアミン、2,6-ジエチルフェネチルアミン、2,6-ジ-イソプロピルフェネチルアミン、2-メトキシフェネチルアミン、2-エトキシフェネチルアミン、2-イソプロポキシフェネチルアミン、3-メトキシフェネチルアミン、3,5-ジメトキシフェネチルアミン、3-n-ブトキシフェネチルアミン、4-n-ブトキシフェネチルアミン、4-エトキシフェネチルアミン、3,4-ジメトキシフェネチルアミン、2-メチルチオフェネチルアミン、2-エチルチオフェネチルアミン、2-イソプロピルチオフェネチルアミン、2-N,N-ジメチルアミノフェネチルアミン、2-フェニルフェネチルアミン、3-フェニルフェネチルアミン、4-フェノキシフェネチルアミン、2-シクロヘキシルフェネチルアミン、2-シクロペンチルフェネチルアミン、2-ニトロフェネチルアミン、2,4-ジニトロフェネチルアミン、2-フルオロフェネチルアミン、2-クロロフェネチルアミン、4-クロロフェネチルアミン、

2,3-ジクロロフェネチルアミン、3,4-ジクロロフェネチルアミン、2-イソプロピル
 -4-ニトロフェネチルアミン、2-イソプロピル-6-ニトロフェネチルアミン、2-ヒド
 ロキシフェネチルアミン、2-N,N-ジメチルアミノカルボニルフェネチルアミン、
 2-N-アセチルフェネチルアミン、2-(1-エチルプロピル)フェネチルアミン、2-
 5 イソプロピル-4-メチルフェネチルアミン、2-イソプロピル-4-ヒドロキシフェネチ
 ルアミン、2-イソプロピル-4-クロロフェネチルアミン、2-イソプロピル-4-アミノ
 フェネチルアミン、2-イソプロピル-5-メチルフェネチルアミン、2-イソプロピル
 -5-ヒドロキシフェネチルアミン、2-イソプロピル-5-クロロフェネチルアミン、4-
 クロロ-3-メチルフェネチルアミン、3,4-メチレンジオキシフェネチルアミン等が
 10 挙げられる。

第2工程

式(IIb)で示される化合物のイソチオシアン酸エステル(イソチオシアナート)
 に、 $\text{NH}_2-\text{CH}_2\text{C}(\text{R}^6)\text{R}^7\text{CH}_2-\text{OH}$ を反応させ、式(IIc)で示される
 化合物を製造する工程である。

15 本工程は、非プロトン性溶媒(例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラ
 ン、N,N-ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロ
 ロホルム等)中で行うことができる。

反応温度としては、 $0^\circ\text{C}\sim 100^\circ\text{C}$ が好ましく、特に $0^\circ\text{C}\sim$ 室温が好ましく、
 反応時間としては、0.5時間 \sim 10時間が好ましい。

20 $\text{NH}_2-\text{CH}_2\text{C}(\text{R}^6)\text{R}^7\text{CH}_2-\text{OH}$ は、化合物(IIb)に対して1.0 \sim
 1.5当量用いればよい。

$\text{NH}_2-\text{CH}_2\text{C}(\text{R}^6)\text{R}^7\text{CH}_2-\text{OH}$ としては、3-アミノプロパノール、3-
 アミノ-2,2-ジメチルプロパノール、3-アミノ-1-メチルプロパノール、3-アミノ-2-
 メチルプロパノール、3-アミノ-3-メチルプロパノール、3-アミノ-2,2-ジエチルブ
 25 ロパノール、1-アミノメチル-1-ヒドロキシメチルシクロプロパン、1-アミノメチ
 ル-1-ヒドロキシメチルシクロペンタン、1-アミノメチル-1-ヒドロキシメチルシク
 ロヘキサン、1-アミノメチル-1-ヒドロキシメチル-4-オキサシクロヘキサン等が挙

げられる。

第3工程

式 (IIc) で示される化合物を閉環させ、式 (II d) で示される化合物を製造する工程である。

- 5 閉環方法としては、(1) ジエチルアゾジカルボキシレート (DEAD) 及びトリフェニルホスフィン (Ph_3P) で処理する方法、(2) 塩酸で処理する方法等が挙げられる。

(1) の場合は、溶媒として非プロトン性溶媒 (例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム等) 等を用い、0.5時間~5時間、0℃~室温で行えばよい。ジエチルアゾジカルボキシレート (DEAD) 及びトリフェニルホスフィン (Ph_3P) は、それぞれ化合物 (IIc) に対して1.0~1.5当量用いればよい。

(2) の場合は、濃塩酸中で0.5時間~10時間、加熱還流すればよい。

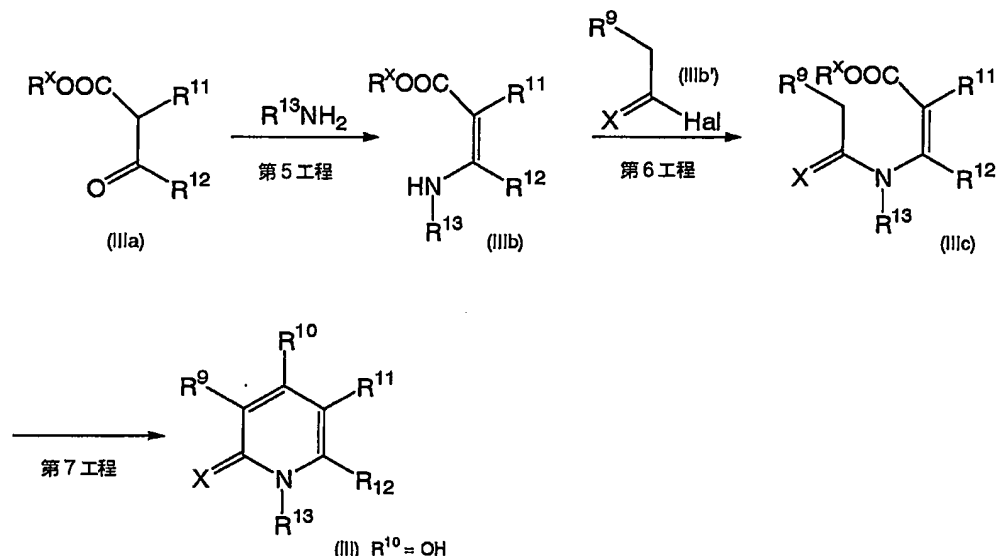
15 第4工程

式 (II d) で示される化合物に、 R^2 を導入し、式 (II) で示される化合物を製造する工程である。

本工程は、塩基 (例えば、トリエチルアミン、ピリジン、N,N-ジメチルアミノピリジン等) の存在下、式： $\text{X}-\text{C}(=\text{Z})\text{W}-\text{R}^8$ (式中、ZはO又はS；WはO又はS； R^8 は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル又は置換されていてもよいアルキニル；Xはハロゲンを表わす) で示される化合物を反応させることにより行うことができる。通常のN-アシル化の条件に従って行えばよく、例えば、溶媒として非プロトン性溶媒 (例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、N,N-ジメチルホルムアミド、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム等) 等を使用し、0℃~100℃で、0.5時間~10時間、反応を行えばよい。

上記 (6) ~ (8) のいずれかに記載の化合物は、以下の製造法に従って製造

することができる。



(式中、各記号は前記と同意義； R^x はアルキル等；Halはハロゲン)

第5工程

- 5 式(IIIa)で示される化合物と式： $R^{13}NH_2$ (式中、 R^{13} は前記と同意義)で示される化合物を反応させ、式(IIIb)で示される化合物を製造する工程である。式(IIIa)で示される化合物の例としては、エチル アセトアセタート、エチル 2-メチルアセトアセタート、エチル 2-エチルアセトアセタート等が挙げられる。
- 式： $R^{13}NH_2$ で示される化合物の例としては、アルキルアミン (例えば、メチルアミン、エチルアミン、*n*-プロピルアミン、*n*-ブチルアミン等)、アラ
- 10 ルキルアミン (例えば、ベンジルアミン、フェネチルアミン等) 等が挙げられる。反応溶媒としては、ベンゼン、トルエン、キシレン等が挙げられ、特にトルエン、キシレンが好ましい。反応温度は、室温～200℃、特に好ましくは80～180℃である。本工程は共沸脱水することにより行うことができ、生成物である式
- 15 (IIIb)で示される化合物は減圧又は常圧下で蒸留等することにより精製することができる。

第6工程

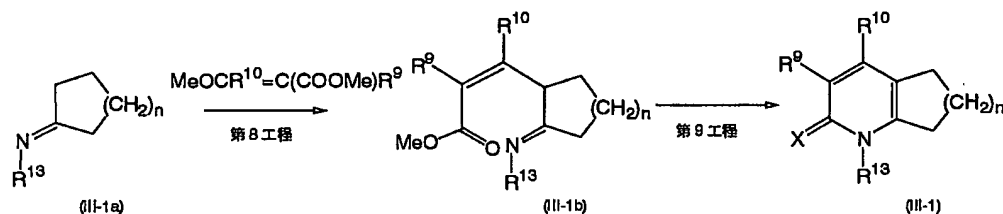
式(IIIb)で示される化合物と式(IIIb')で示される化合物を塩基の存在下で反応させ、式(IIIc)で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、ピ

リジン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン等が挙げられ、特にピリジンが好ましい。反応溶媒としては、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、塩化メチレン、トルエン等が挙げられ、特にジエチルエーテルが好ましい。反応温度は、0～200℃、特に好ましくは室温～100℃である。

5 第7工程

式(IIIc)で示される化合物を塩基の存在下閉環させ、式(III)で示される化合物を製造する工程である。塩基としては、金属ナトリウム、金属アルコキシド(例えば、ソジウムメトキシド等)が使用される。反応溶媒としては、アルコール(例えば、メタノール、エタノール)とベンゼン又はトルエン等との混合溶媒

10 が好ましい。反応温度は、0～200℃、特に好ましくは室温～100℃である。



(式中、各記号は前記と同意義；nは1以上の整数である)

第8工程

式(III-1a)で示される化合物に式： $\text{MeOCR}^{10}=\text{C}(\text{COOMe})\text{R}^9$ で示される化合物を反応させ、式(III-1b)で示される化合物を得る工程である。式： $\text{MeOCR}^{10}=\text{C}(\text{COOMe})\text{R}^9$ で示される化合物としては、メトキシメチレンマロン酸ジメチル、メトキシメチレンマロン酸ジエチル等があげられる。反応溶媒としては、ジグライム、トルエン等が挙げられる。反応温度は、室温～200℃、好ましくは100℃～150℃である。

20 第9工程

式(III-1b)で示される化合物を加温して、式(III-1)で示される化合物を製造する工程である。本工程は、反応溶媒としてジグライム又はトルエンを使用し、室温～200℃、特に100℃～150℃で行うのが好ましい。なお、第8工程と第9工程は連続して、即ち式(III-1b)で示される化合物を単離せずに行っても

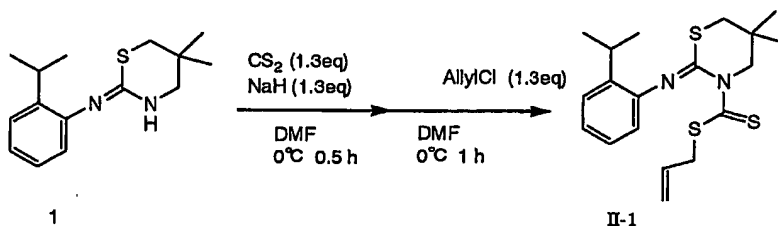
よい。

上記（９）記載の化合物は、WO97/29079 記載の製造法に従って製造することができる。上記（１０）記載の化合物は、WO99/02499 記載の製造法に従って製造することができる。上記（１１）記載の化合物は、WO00/40562 記載の製造法
 5 に従って製造することができる。上記（１２）～（２３）のいずれかに記載の化合物も、それぞれの文献を参考にして製造することができる。

実施例

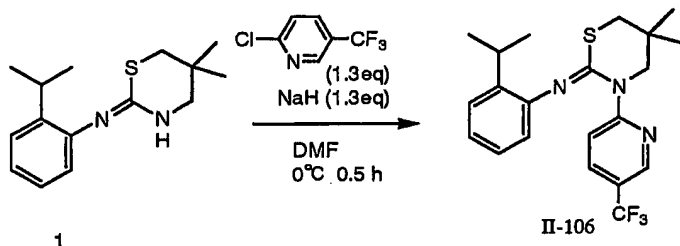
例えば、本発明に使用されるカンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化
 10 合物は、以下のように製造することができる。

実施例 A 2-（2-イソプロピルフェニル）イミノ-3-（アリルチオ）チオカルボニル-5, 5-ジメチル-1, 3-チアジン（化合物 II-1）の製造



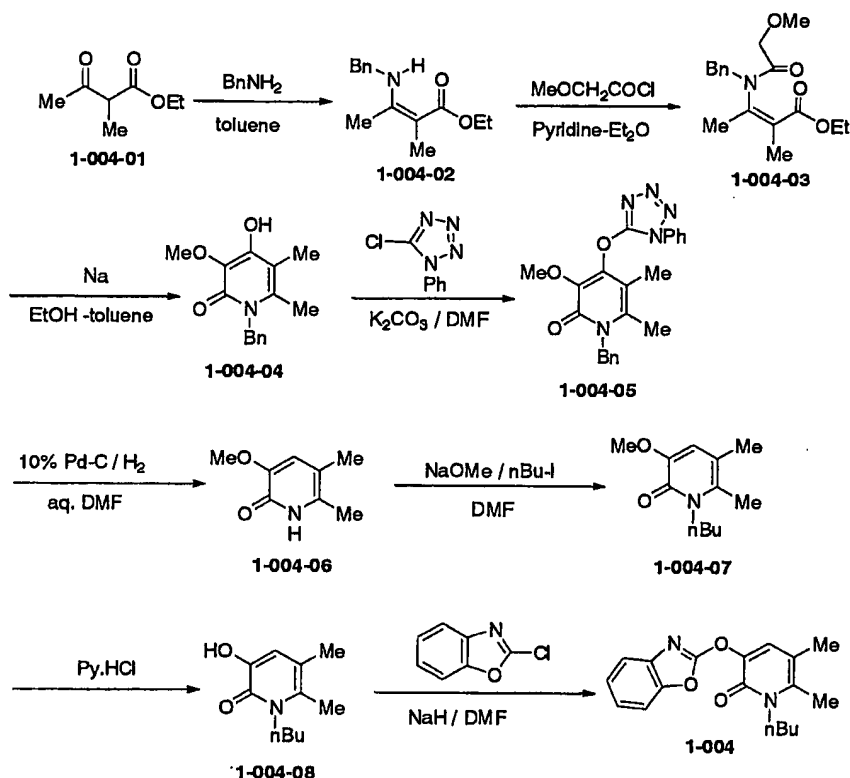
15 WO01/19807 記載の方法によって得られた 2-（2-イソプロピルフェニル）イミノ-5, 5-ジメチル-1, 3-チアジン(0.26 g)、二硫化炭素(0.10 g)、N, N-ジメチルホルムアミド(3 mL)の混合液に、60%水素化ナトリウム(0.05 g)を氷冷下で加えた。30 分間攪拌後、アリルクロリド(0.10 g)を加え、0℃で1時間攪拌した。反応液に水(80 mL)を加え、ジエチルエーテル(100 mL)で抽出した。
 20 抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル）で精製し、2-（2-イソプロピルフェニル）イミノ-3-（アリルチオ）チオカルボニル-5, 5-ジメチル-1, 3-チアジン(0.26 g、収率 69%)を淡黄色油状物として得た。

実施例B 2-(2-イソプロピルフェニル)イミノ-3-(5-トリフルオロメチル-2-ピリジル)-5,5-ジメチル-1,3-チアジン(化合物II-106)の製造



- 5 WO01/19807 記載の方法によって得られた2-(2-イソプロピルフェニル)イミノ-5,5-ジメチル-1,3-チアジン(0.26 g)、5-トリフルオロメチル-2-クロロピリジン(0.24 g)、N,N-ジメチルホルムアミド(3 mL)の混合液に、60%水素化ナトリウム(0.05 g)を氷冷下で加えた。室温で2時間攪拌後、水(80 mL)を加え、ジエチルエーテル(100 mL)で抽出した。無水硫酸マグネシウム
- 10 で乾燥後、減圧濃縮してた。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(グラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル)で精製し、2-(2-イソプロピルフェニル)イミノ-3-(5-トリフルオロメチル-2-ピリジル)-5,5-ジメチル-1,3-チアジン(0.13 g、収率32%)を無色油状物として得た。

15 実施例C



a) エチル 3-ベンジルアミノ-2-メチルクロトナート(1-004-02)の合成

エチル 2-メチルアセトアセタート(1-004-01)(115.34 g)、ベンジルアミン(85.73 g)、トルエン(1.6 L)の溶液を、窒素気流中 145 °C の油浴で 8 時間共沸脱水を行った。ベンジルアミン(12.86 g)を追加し、更に脱水を行った。6 時間後、常圧蒸留を行い約 600 mL を留去した。さらに減圧留去し、エチル 3-ベンジルアミノ-2-メチルクロトナート(1-004-02)(195.66 g)を得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.28(t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.80 (s, 3H), 1.93 (s, 3H), 4.13 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 4.43 (d, *J* = 6.3 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 9.65 (brs, 1H).

b) エチル 3-(*N*-ベンジルメトキシアセタミド)-2-メチルクロトナート(1-004-03)の合成

エチル 3-ベンジルアミノ-2-メチルクロトナート(1-004-02)(97.83 g)をエーテル(2 L)に溶解し、窒素気流中氷冷下で攪拌した。ピリジン(35.6 mL)を添加後、内温 5 ~ 6 °C でメトキシアセチルクロリド(40.2 mL)のエーテル溶液を 45

分で滴下した。30分攪拌後、さらに室温で2時間攪拌した。反応混合物を氷水(1.5 L)中に注入し、エーテルで2回抽出した。抽出液を、水洗(1 L)1回後、重曹水溶液で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去し、エチル 3-(*N*-ベンジルメトキシアセタミド)-2-メチルクロトナート(1-004-03)(111.47 g, 5 91.3%)を油状物として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.21 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.89 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.97 (d, *J* = 14.7 Hz, 1H), 3.98 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 4.12 (d, *J* = 14.7 Hz, 1H), 4.31 (d, *J* = 14.4 Hz, 1H), 4.95 (d, *J* = 14.4 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).

c) 1-ベンジル-5, 6-ジメチル-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2-
10 ピリドン(1-004-04)の合成

窒素気流中、トルエン(1.39 L)及びエタノール(2.08 mL)の溶液中に金属ナトリウム片(7.98 g)を加え入れ、140℃油浴中で攪拌還流した。反応液にエチル(1-ベンジル)-メトキシアセタミド-2-メチルクロトナート(1-004-03)(105.93 g)のトルエン(340 mL)溶液を1時間20分で滴下し、攪拌還流を行っ
15 た。2時間後、反応混合物を氷冷攪拌し、4 N塩酸-ジオキサン(86.8 mL)を10分で滴下した。室温で2時間攪拌後、析出物をろ取した。トルエンで洗浄し、得られた析出物(73.16 g)にクロロホルム(500 mL)と水(500 mL)を加えた。65℃水浴上で加温溶解し、振とう分液後、さらにクロロホルム(250 mL)で抽出した。水洗(250 mL)1回行った後、硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧留去後、残渣(54.95
20 g)を酢酸エチルエステル(50 mL)及びエーテル(50 mL)で洗浄し、1-ベンジル-5, 6-ジメチル-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-04)(53.95 g, 60.0%)を膚色結晶として得た。

融点: 212℃。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.03 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 3.99 (s, 3H), 5.38 (brs, 2H), 6.41 (brs, 1H), 7.11-7.33 (m, 5H).

d) 1-ベンジル-5, 6-ジメチル-3-メトキシ-4-O-(1-フェニル-1*H*-テトラゾリル)-2-ピリドン(1-004-05)の合成

1-ベンジル-5, 6-ジメチル-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2-ピリ
ドン(1-004-04)(25.93 g)、5-クロロ-1-フェニル-1*H*-テトラゾール
(21.67 g)、および炭酸カリウム (27.64 g)に、窒素気流中DMF (300 mL)を加え
た。懸濁液を室温で4.5時間攪拌後、反応液を氷水(1 L)中に注入し、酢酸エチ
5 ル(500 mL)で3回抽出した。2回水洗(500 mL)し、硫酸マグネシウムで乾燥後、
減圧留去した。残渣(42.4 g)をアセトン(300 mL)に加温溶解し、減圧濃縮後、エ
ーテル(300 mL)を加えた。析出した結晶を濾取し、1-ベンジル-5, 6-ジメ
チル-3-メトキシ-4-*O*-(1-フェニル-1*H*-テトラゾリル)-2-ピ
リドン(1-004-05)(29.87 g, 74.0%, 融点: 178°C)を得た。濾液は濃縮後、シリ
10 カゲルカラムクロマトグラフィー(150g, CHCl₃)で精製し、1-004-05 (4.3g, 10.7%)
を得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.41 (brs,
2H), 7.15-7.84 (m, 10H).

e) 5, 6-ジメチル-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-06)の合成

15 1-ベンジル-5, 6-ジメチル-3-メトキシ-4-*O*-(1-フェニル-
1*H*-テトラゾリル)-2-ピリドン(1-004-05)(27.15 g)のDMF (272 mL)溶液
に10%パラジウム炭素(5.43 g)の水(27 mL)懸濁液を加え、室温で中圧還元(5
kg/cm²加圧下)を行った。途中で10%パラジウム炭素(2.72 g)を追加した。4
8時間後、触媒をセライト上で濾去し、メタノール洗浄後減圧留去した。残渣に
20 水(160 mL)を加え、85°C水浴上で加熱した。不溶物を濾去し、熱水で洗浄後(不
溶物、8.77 g)減圧留去した。残渣(11.55 g)にアセトン(110 mL)を加え、室温攪
拌後、無色粉末を濾取し1-004-06 (8.23g, 79.8%, 融点: 215-219°C)を得
た。濾液を濃縮後、残渣から同様な処理により、1-004-06 (0.31 g, 3.0%)を得た。
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.41 (brs,
25 2H), 7.15-7.84 (m, 10H).

f) 1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-07)
の合成

5, 6-ジメチル-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-06)(306 mg)及び水酸化カリウム(157 mg)にn-ブタノール(18 mL)を加えた。懸濁液に窒素気流中、1-ヨードブタン(0.44 mL)を加え、85℃油浴中で加熱攪拌した。24時間後、反応液を減圧留去し、残渣を酢酸エチルと水で溶解した。酢酸エチルで2回抽出後、水洗1回行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。残渣(330 mg)をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ローバーカラムB、トルエン-アセトン(3:1))で精製し、1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-07)(124 mg, 29.6%)を得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.96 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.08 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 6.44 (s, 1H).

g) 1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-ピリドン(1-004-08)の合成

1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-07)(124 mg)にピリジニウムクロリド(293 mg)を加え、窒素気流中、200℃油浴中で加熱攪拌した。30分後、反応液にエーテル及び水を加え、溶解後、エーテルで2回抽出した。水洗1回行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去し、1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-ピリドン(1-004-08)(94 mg, 81%)を得た。

融点: 112-116℃

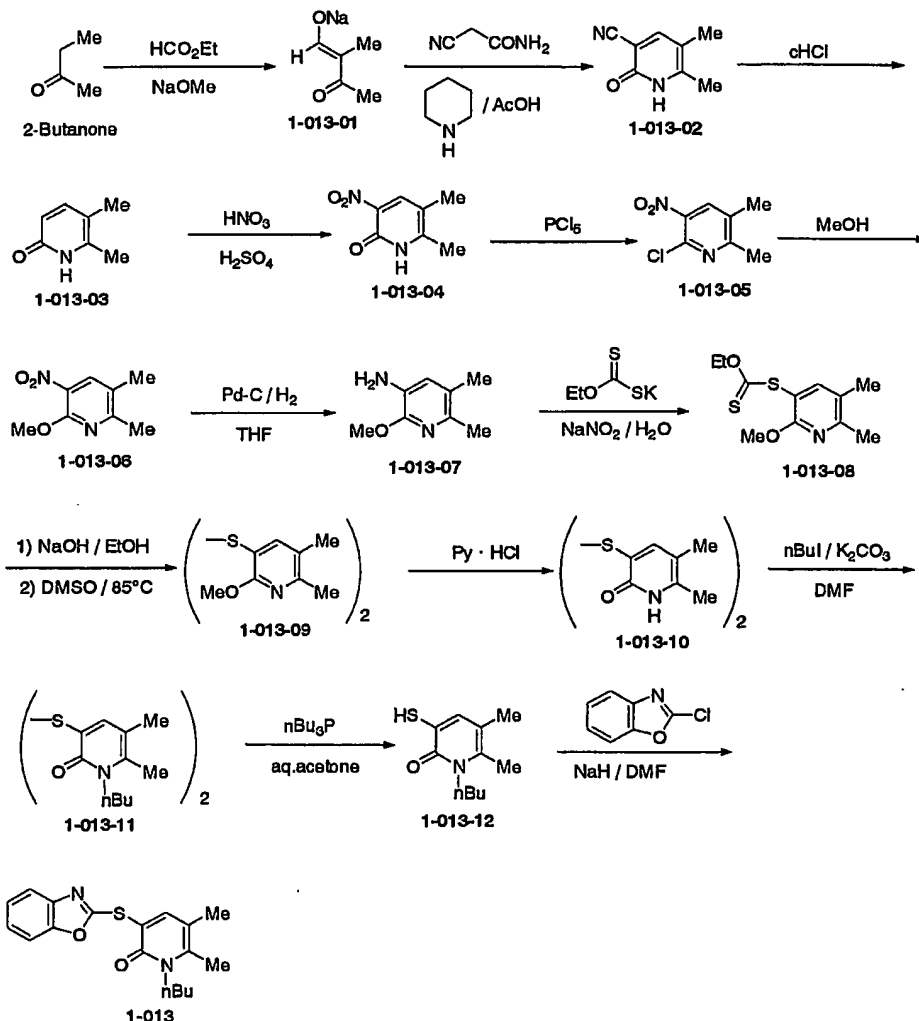
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.98 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 4.10 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 6.66 (brs, 2H).

h) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ブチル-5, 6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-オン(1-004)の合成

1-015と同様に行った(66.7%)。

融点: 106-108℃

実施例 D



a) 2-メチルー3-オキソブタナール ナトリウム塩(1-013-01)の合成

28%ナトリウムメトキシドメタノール溶液(138 mL)に窒素気流中、エーテル(920 mL)を加え希釈した。氷冷攪拌下、2-ブタノン(51.2 g)とエチルホルメート(57.2 g)の混合物を、内温4~6℃にて45分で滴下した。30分攪拌後、一晚室温攪拌を行った。析出した無色粉末をろ取し、2-メチルー3-オキソブタナール ナトリウム塩(1-013-01)(60.66 g, 70%)を得た。

$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): δ 1.62 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 8.99 (s, 1H).

b) 3-シアノー5,6-ジメチルー2-ピリドン(1-013-02)の合成

2-メチルー3-オキソブタナール ナトリウム塩(1-013-01)(34.73 g)に水

(546 mL)、2-シアノアセタミド(23.91 g)、続いて1.76モル ピペリジニウムアセタート(119.4 mL)を加え、127℃油浴中で攪拌還流した。21時間後、反応液に内温65℃で酢酸(42.7 mL)を少しずつ加えた(15分)。内温24℃になるまで攪拌を続け、析出した結晶をろ取し、水洗して3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(1-013-02)(27.76 g, 65.9%)を得た。

融点：258-263℃

¹H NMR (300 MHz, DMSO): δ 1.98 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 7.95 (s, 1H), 12.45 (brs, 1H).

c) 5,6-ジメチル-2-ピリドン(1-013-03)の合成

10 3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(1-013-02)(12.0 g)の水(293 mL)の懸濁液に、濃塩酸(293 mL)を加え、135℃油浴中で攪拌還流した。3日後、反応液を冷却し、減圧留去した。残渣(24.75 g)にクロロホルム(300 mL)とメタノール(15 mL)を加え、65℃水浴上で加温し、不溶物をろ去した。不溶物をクロロホルム(200 mL)とメタノール(10 mL)で同様に処理した。濾液をあわせ、減圧留去した。残渣(13.26 g)にメタノール(150 mL)、炭酸カリウム(10 g)を加え、30分室温攪拌後、不溶物をろ去し、減圧留去した。残渣(14.7 g)にクロロホルム(200 mL)を加え、再び不溶物をろ去し、減圧留去して5,6-ジメチル-2-ピリドン(1-013-03)(9.41g, 94.3%)を得た。

融点：202-207℃

20 ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.05 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 6.38 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 7.26 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 13.17 (brs, 1H).

d) 5,6-ジメチル-3-ニトロ-2-ピリドン(1-013-04)の合成

5,6-ジメチル-2-ピリドン(1-013-03)(3.695 g)に氷冷下、濃硫酸(38 mL)を加えて溶解した。氷冷攪拌下、70%硝酸(3.53 mL)を内温3~5℃で50分で滴下した。2時間攪拌後、反応液を氷中に少しずつ加え入れた。析出した結晶をろ取し、水洗して5,6-ジメチル-3-ニトロ-2-ピリドン(1-013-04)(3.102 g, 61.5%, 融点：251-257(分解))を得た。また、水層をクロロホルムで5

回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。析出した結晶をろ取し、更に 271 mg (5.4%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, DMSO): δ 2.06 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 12.79 (brs, 1H).

5 e) 2-クロロ-5, 6-ジメチル-3-ニトロピリジン(1-013-05)の合成

5, 6-ジメチル-3-ニトロ-2-ピリドン(1-013-04)(841 mg)及び五塩化
リン(1.25 g)を窒素気流中、140℃油浴中で加熱攪拌した。35分後、反応液を
氷冷し、氷水中に注入した。クロロホルムで2回抽出し、水洗1回後、飽和重曹
水で洗浄した。脱色炭を加え、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去し、結晶性
10 残渣の2-クロロ-5, 6-ジメチル-3-ニトロピリジン(1-013-05)(842mg,
90.2%)を得た。

$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): δ 2.38 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 8.01 (s, 1H).

f) 5, 6-ジメチル-2-メトキシ-3-ニトロピリジン(1-013-06)の合成

28%ナトリウムメトキシド(1.11 mL)のメタノール(5.5 mL)溶液を窒素気流
15 中、室温で攪拌した。反応液に2-クロロ-5, 6-ジメチル-3-ニトロピリ
ジン(1-013-05) (837 mg)のメタノール(6.6 mL)溶液を5分で滴下し、50℃油浴
中で7時間加熱攪拌した。反応液にエーテルを加え、水中に注ぎ入れ、エーテル
2回抽出した。水洗1回行い、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧留去してオレンジ
20 色結晶の5, 6-ジメチル-2-メトキシ-3-ニトロピリジン(1-013-
06)(675 mg, 82.6%)を得た。

融点: 71-73℃

$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): δ 2.28 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 4.08 (s, 3H), 8.07 (s, 1H).

g) 3-アミノ-5, 6-ジメチル-2-メトキシピリジン(1-013-07)の合成

25 5, 6-ジメチル-2-メトキシ-3-ニトロピリジン(1-013-06)(2.56 g)をテ
トラヒドロフラン(41 mL)に溶解し5%パラジウム炭素(450 mg)のメタノール(41
mL)懸濁液を加え、接触還元を行った。3時間後、触媒をろ去し、減圧留去して

褐色結晶の 3-アミノ-5, 6-ジメチル-2-メトキシピリジン(1-013-07)
(2.096 g, 97.9%)を得た。

融点: 56-58 °C

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.12 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.48-3.49 (brs, 2H),
5 3.95 (s, 3H), 6.70 (s, 1H).

h) 5, 6-ジメチル-3-[[エトキシ(チオカルボニル)]チオ]-2-メ
トキシピリジン(1-013-08)の合成

3-アミノ-5, 6-ジメチル-2-メトキシピリジン(1-013-07)(1.787 g)を
水(3 mL)と濃塩酸(3 mL)に溶解後、氷-アセトン冷浴下、攪拌した。反応液に、
10 亜硝酸ソーダ(4.81 g)の水(27.1 mL)溶液を内温-4~-5 °Cで45分で滴下後、2
0分攪拌した。一方、エチルキサントゲン酸カリウム(12.64 g)の水溶液(17.3 mL)
を、40 °C油浴中で加温攪拌下し、その中に先に調製したジアソニウム塩の冷却
溶液を35分に加えた。40分加熱攪拌後、反応液を氷冷した。クロロホルムで
3回抽出し、飽和重曹水1回、次いで飽和食塩水1回洗浄後、硫酸マグネシウム
15 で乾燥した。減圧留去し、赤色オイルの残渣(12.49 g)をシリカゲルカラムクロマ
トグラフィー(300g, トルエン-ヘキサン(2:3))で精製し、5, 6-ジメチル-3-
[[エトキシ(チオカルボニル)]チオ]-2-メトキシピリジン(1-013-08)(6.281
g, 36%)を赤色液体として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.33 と 1.45 (t, *J* = 7.2 Hz, total 3H), 2.18 と 2.21
20 (s, total 3H), 2.39 と 2.44 (s, total 3H), 3.94 と 3.98 (s, total 3H), 4.60 と 4.70 (q,
J = 7.2 Hz, total 2H), 7.43 と 7.47 (s, total 1H).

i) (5, 6-ジメチル-2-メトキシピリジン-3-イル)ジスルフィド(1-
013-09)の合成

5, 6-ジメチル-3-[[エトキシ(チオカルボニル)]チオ]-2-メト
25 キシピリジン(1-013-08)(6.275 g)をエタノール(200 mL)に溶解し、窒素気流中、
室温で攪拌した。反応液に1 N水酸化ナトリウム(67 mL)を一時的に加え入れ、1
5時間攪拌した。析出物をろ取り、水洗して析出物(543 mg)を得た。また、ろ液

に 5 N 塩酸水溶液を加え pH 3 とし、減圧留去した。残渣(7.6 g)に塩化メチレン(100 mL)を加え、室温攪拌後、不溶物をろ去し、減圧留去して析出物(2.00 g)を得た。

得られた析出物 2.00 g と 543 mg をあわせ、ジメチルスルホキサイド(20 mL)を加えた。懸濁液を、窒素気流中、85 °C 油浴中で加熱攪拌した。7 時間後、反応液に室温攪拌下、水(100 mL)を加え入れ、30 分間氷冷攪拌した。析出物を濾取して、(5, 6-ジメチル-2-メトキシピリジン-3-イル)ジスルフィド(1-013-09)(2.23 g, 54.4%)を黄色粉末として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.16 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 7.53 (s, 1H).

j) (5, 6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルフィド(1-013-10)の合成

(5, 6-ジメチル-2-メトキシピリジン-3-イル)ジスルフィド(1-013-09)(2.225 g)にピリジニウムクロリド(7.69 g)を加え、窒素気流中、160 °C 油浴中で加熱攪拌した。40 分後、反応液を冷却し、水(100 mL)を加え、室温で攪拌した。ろ取し、水洗して(5, 6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルフィド(1-013-10)(1.736 g, 85.1%)を褐色粉末として得た。また、水層をクロロホルムで 2 回抽出し、水洗 2 回行い、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣(81 mg)をエタノールで洗い、さらに目的物(41 mg, 2.0%)を黄色粉末として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.95 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 7.42 (s, 1H), 11.89 (brs, 1H).

k) (1-ブチル-5, 6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルフィド(1-013-11)の合成

(5, 6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルフィド(1-013-10) (31 mg)の DMF (1 mL)懸濁液に、1-ヨードブタン(78 mg)および炭酸カリウム(42 mg)を加え、窒素気流中、3 日間室温攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、水

中に注ぎ入れ、酢酸エチルで2回抽出した。水洗1回行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去して1-ブチル体(1-013-11)を含む粗製物(39 mg, 92.9%)を得た(NMRより1-ブチル体の含量は20%)。

1) 1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-メルカプト-2-ピリドン(1-013-12)

5 の合成

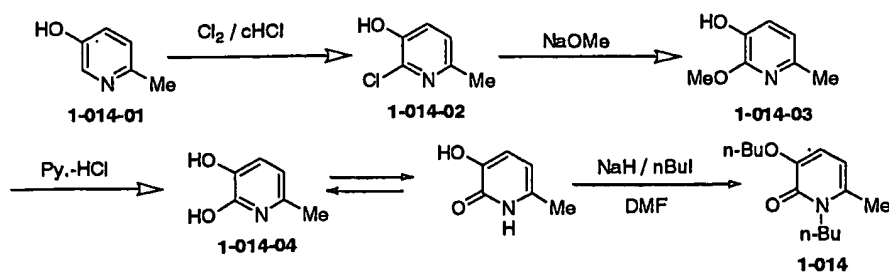
(1-ブチル-5, 6-ジメチル-2-ピリドン-3-イル)ジスルフィド(1-013-11)(123 mg)をアセトン(8 mL)に溶解し、室温攪拌下、トリ-n-ブチルホスフィン(0.16 mL)を加えた。さらに水(4 mL)を少しずつ加え、2時間攪拌後、一晩室温放置した。反応液を塩化メチレンで希釈し、水を加えた。塩化メチレンで2回抽出し、水洗1回、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。残渣(277 mg)を分取薄層クロマトグラフィー(トルエン-アセトン(39:1))で精製し、結晶性の1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-メルカプト-2-ピリドン(1-013-12)(11 mg, 8.9%)を得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.93 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.62-1.72 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 4.20 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.68 (s, 1H).

m) 1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-(ベンズオキサゾール-2-イル)チオ-2-ピリドン(1-013)の合成

先の実施例 1-015 と同様に行い、1-ブチル-5, 6-ジメチル-3-メルカプト-2-ピリドン(11 mg)から、結晶性の 1-013 (4.5 mg, 26.5%)を得た。

実施例 E



a) 2-クロロ-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-02)の合成

5-ヒドロキシ-2-メチルピリジン(1-014-01)(27.01 g)に濃塩酸(200 mL)を加えて溶解し、68-74℃にて塩素ガスを7時間通じた。反応液を一夜放置後、窒素ガスを通じ揮発性物を除去し、減圧濃縮して結晶性残渣を得た。メタノールに溶かし、活性炭処理後、再結晶して2-クロロ-3-ヒドロキシ-6-メチル
5 ピリジン(1-014-02)(23.96 g, 67.3%)を得た。

b) 2-メトキシ-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-03)の合成

金属製封管に2-クロロ-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-02)(22.91 g)および28%ナトリウムメトキシド-メタノール溶液(120 mL)を加え、150℃で3日間反応した。反応液に氷水(100 mL)を加え、酢酸で中和後、乾固
10 した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(クロロホルム)で精製し、2-メトキシ-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-03)(10.44 g, 48.1%)を得た。なお、原料を含むフラクションは再度反応に供した。

¹NMR (300MHz, CDCl₃): δ 2.35 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 6.60 (d, *J* = 7.8Hz, 1H), 6.98 (d, *J* = 7.8Hz, 1H).

15 c) 2, 3-ジヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-04)の合成

2-メトキシ-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-03)(10.43 g)にピリジン塩酸塩(43.3 g)を加え、窒素気流下160℃で1時間、さらに170℃で20分加熱した。反応液に水(50 mL)を加え、5%メタノール/酢酸エチルおよび酢酸エチルで抽出を繰り返した。抽出液を濃縮乾固して、灰白色の2, 3-
20 ジヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-04)を得、精製することなく次の反応に用いた。

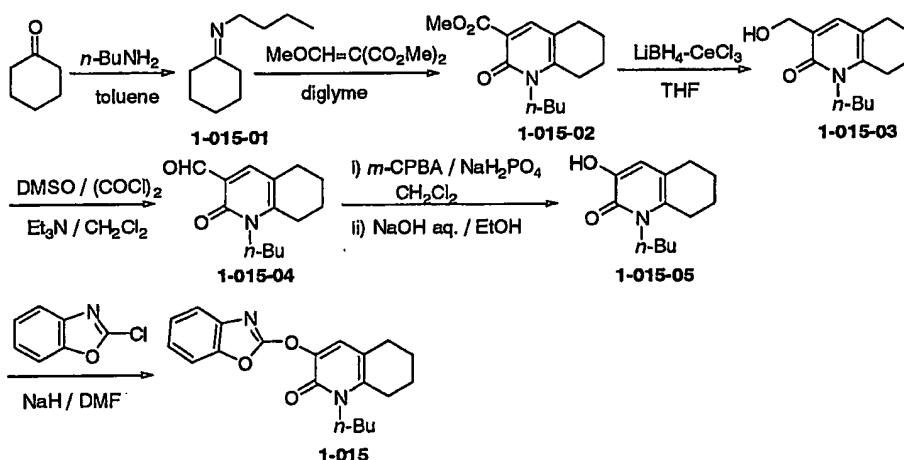
d) 1-ブチル-3-ブチル-6-メチル-2-ピリドン(1-014-05)の合成

粗製の2, 3-ジヒドロキシ-6-メチルピリジン(1-014-04)(16.04 g)を乾燥DMF(70 mL)に溶かし、60%水素化ナトリウム(10.25 g)を少量ずつ加え、窒
25 素下室温で30分攪拌した。つぎに1-ヨードブタン(29.1 mL)-DMF(30 mL)よりなる溶液を20分で滴下、室温で3時間攪拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチル(150 mL)で3回抽出した。さらに水層をクロロホルム

でかさねて抽出した。有機層を併せ、活性炭処理後、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(*n*-ヘキサン-酢酸エチル)で精製し、1-ブチル-3-
 0-ブチル-6-メチル-2-ピリドン(1-014)(8.915 g)を油状物として得た(2
 工程の通算収率 50.1%)。

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ 0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 6H), 1.43 (m, 4H), 1.67 (m, 2H),
 1.82 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 3.88 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 5.87
 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 6.52 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H).

実施例 F



10

a) N-n-ブチル-N-シクロヘキシリデンアミン(1-015-01)の合成

シクロヘキサノン(10.36 mL, 0.1 mol)に、*n*-ブチルアミン (9.88 mL, 0.1
 mol)とトルエン(15 mL)を加え、モレキュラーシーブ 4 Å を入れたディーンスタ
 ーク還流管を用いて脱水条件下、24時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却
 15 後減圧濃縮し、残渣を減圧蒸留(64°C, 2 mmHg)して、N-n-ブチル-N-シク
 ロヘキシリデンアミン(1-015-01) (12.8 g, 84%)を無色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): δ 0.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.35 (sextet, $J = 7.5$ Hz,
 2H), 1.58 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.61-1.70 (m, 4H), 1.71-1.77 (m, 2H), 2.30 (t,
 $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.34 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.30 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H).

20 b) 1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノ

リン-3-カルボン酸メチルエステル(1-015-02)の合成

N-n-ブチル-N-シクロヘキシリデンアミン(1-015-01)(12.8 g, 83.6 mmol)をジグライム(75 mL)に溶解し、120℃に加熱した。反応液にメトキシメチレンマロン酸ジメチル(14 g, 80.4 mmol)のジグライム溶液(75 mL)を1時間かけて滴下し、さらに120℃で3時間加熱した。反応液を冷却後、ジグライムを減圧留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製して、1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-3-カルボン酸メチルエステル(1-015-02)(15 g, 71%)を黄色油状物質として得た。

10 ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.97 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.87 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.57 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.02 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.92 (s, 1H).

c) 1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015-03)の合成

15 1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-3-カルボン酸メチルエステル(1-015-02)(130 mg, 0.5 mmol)をTHF(12 mL)に溶解し、CeCl₃·7H₂O (372.6 mg, 1 mmol)と水素化ホウ素リチウム(21.8 mg, 1 mmol)を加え、室温で20分攪拌した。反応液に1*N*塩酸(20 mL)を加え、酢酸エチル(40 mL)で抽出後、飽和食塩水(30 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をもう一度上記と同じ条件で反応させ、同様の後処理を行った。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製して、1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015-03) (80 mg, 68%)を無色油状物質として得た。

25 ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.98 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.71 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.85 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.52 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, *J* = 7.8 Hz,

2H), 4.53 (s, 2H), 7.02 (s, 1H).

d) 1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボアルデヒド(1-015-04)の合成

DMSO(0.54 mL, 7.64 mmol)を塩化メチレン(27 mL)に溶解し、-78℃に冷却した。この溶液にオキサリルクロリド(0.4 mL, 4.58 mmol)ならびに1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン (1-015-03)(0.9 g, 3.82 mmol)の塩化メチレン溶液(20 mL)を順次滴下した。トリエチルアミン(1.33 mL, 9.55 mmol)を加え、-78℃で5分攪拌した後、徐々に室温へ昇温した。室温でさらに20分攪拌した後、反応液に1*N*塩酸(50 mL)を加え、酢酸エチル(200 mL)で抽出後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(50 mL)、飽和食塩水(50 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製して、1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボアルデヒド(1-015-04)(0.5 g, 56%)を淡黄色泡状物質として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.99 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.68 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.59 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.76 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.76 (s, 1H), 10.34 (s, 1H).

e) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015-05)の合成

1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボアルデヒド(1-015-04)(160 mg, 0.69 mmol)を塩化メチレン(10 mL)に溶解し、NaH₂PO₄ · H₂O (190 mg, 1.38 mmol)とメタクロロ過安息香酸(237 mg, 1.38 mmol)を加え、室温で30分攪拌した。反応液に5%チオ硫酸ナトリウム水溶液(20 mL)を加え、酢酸エチル(50 mL)で抽出後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (20 mL)、飽和食塩水(20 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をエタノール(5 mL)に溶解し、2*M*水酸化ナトリウム水溶液(0.35

mL, 0.7 mmol)を加え、室温で30分撹拌した。反応液に0.2 N塩酸(7 mL)を加え、酢酸エチル(25 mL)で抽出後、飽和食塩水(10 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製して、1-ブチル-3-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015-05) (82 mg, 54%)を淡褐色結晶として得た。

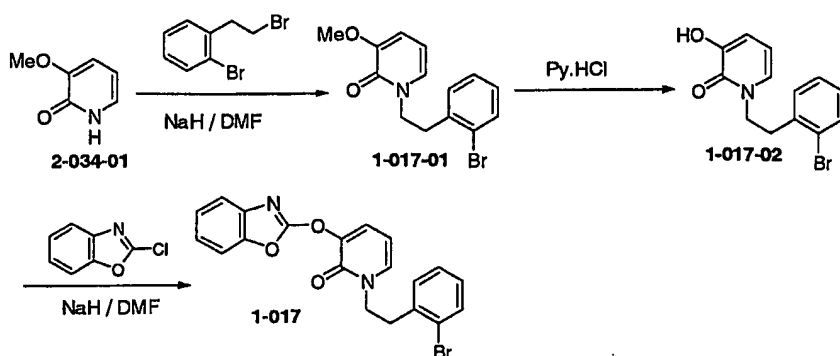
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.97 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.74 (m, 4H), 1.83 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.50 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 6.57 (s, 1H).

f) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015-05)(10 mg, 0.045 mmol)をDMF(1 mL)に溶解し、60%水素化ナトリウム(2.7 mg, 0.068 mmol)を加え、室温で5分激しく撹拌した。反応液に2-クロロベンゾオキサゾール (7.7 μL, 0.068 mmol)を加え、室温で20分撹拌後、1 N塩酸(3 mL)を加えた。酢酸エチル(8 mL)で抽出、飽和食塩水(4 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製して、3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン(1-015) (12 mg, 79%)を淡黄色粉末として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.94 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.40 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.58 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.40 (dd, *J* = 6.9 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.48 (dd, *J* = 6.9 Hz, 2.4 Hz, 1H).

実施例 G



a) 1-(2-ブロモフェネチル)-3-メトキシ-2-ピリドン(1-017-01)の合成

2-034-02と同様にして合成した(44%)。

5 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 3.22 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 4.21 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 5.96 (t, $J = 7.3$ Hz, 1H), 6.60 (m, 2H), 7.07-7.22 (m, 3H), 7.55 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H).

b) 1-(2-ブロモフェネチル)-3-ヒドロキシ-2-ピリドン(1-017-02)の合成

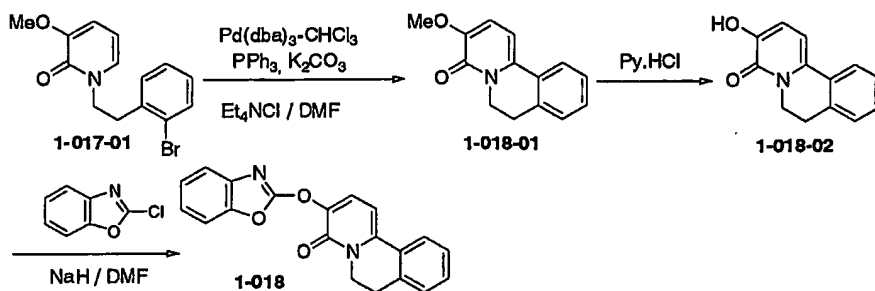
10 1-004-08と同様にして合成した(100%)。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 3.23 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 4.23 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 6.02 (t, $J = 7.0$ Hz, 1H), 6.57 (dd, $J = 7.0, 1.2$ Hz, 1H), 6.78 (dd, $J = 7.3, 1.8$ Hz, 1H), 7.08-7.14 (m, 2H), 7.18-7.23 (m, 1H), 7.56 (dd, $J = 7.0, 1.2$ Hz, 1H).

c) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-(2-ブロモフェネチル)-2-ピリドン(1-017)の合成

1-015と同様にして合成した(70%)。

実施例 H



a) 3-メトキシ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-オン(1-018-01)の合成

1-(2-ブロモフェネチル)-3-メトキシ-2-ピリドン(1-017-01)(100
5 mg) の DMF (4.0 mL) 溶液に、室温で $\text{Pd}(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$ (30 mg)、 Et_4NCl (54 mg)、
及び炭酸カリウム(67 mg)を加えた。120℃で3時間攪拌した後、溶媒を留去し、
残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機層を分離した。水層
を酢酸エチルで3回抽出し、合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い、無水
硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物を分取
10 薄層クロマトグラフィー(トルエン/アセトン=1/1)で精製して、3-メトキシ-
6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-オン(1-017-02)(50.6
mg, 69%)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 2.97 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.34 (t, $J =$
6.3 Hz, 2H), 6.64 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 6.74 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.23-7.34 (m, 3H),
15 7.64-7.67 (m, 1H).

b) 3-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-4-
オン(1-018-02)の合成

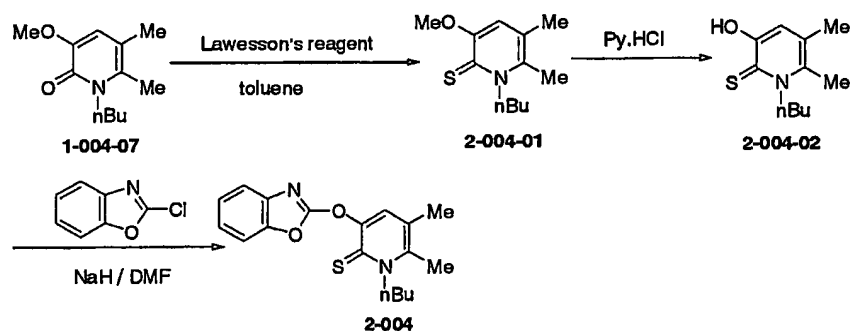
1-004-08と同様にして合成した(98%)。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 3.00 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.35 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H),
20 6.71 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.24-7.34 (m, 3H), 7.64-7.68
(m, 1H).

d) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-6,7-ジヒドロピリド[2,
1,a]イソキノリン-4-オン(1-018)の合成

1-004 と同様にして合成した(47%)。

実施例 I



- 5 a) 1-ブチル-5,6-ジメチル-3-メトキシ-2-チオピリドン(2-004-01)の合成

1-ブチル-5,6-ジメチル-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-07) (222 mg)及びローソン試薬(502 mg)にトルエン(8 mL)を加え懸濁し、窒素気流中、攪拌還流を行った。7時間後、反応液にメタノール(25 mL)を加え 室温で1時間攪拌後、減圧留去した。残渣(0.80 g)をローバーカラムBを用いてシリカゲルカラムクロマトグラフィー(トルエン/アセトン(4:1))を行い、1-ブチル-5,6-ジメチル-3-メトキシ-2-チオピリドン(2-004-01) (177 mg, 74.1%)を得た。

融点：111-112℃

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.00 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 1.70-1.95 (brs, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 4.90 (brs, 2H), 6.54 (s, 1H).

- b) 1-ブチル-5,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオピリドン(2-004-02)の合成

1-013-10と同様に行うことにより、2-004-01 (170 mg)から1-ブチル-5,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオピリドン(2-004-02) (118 mg, 74.2%)を得た。

融点：81-88℃

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 1.02 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.45-1.57 (m, 2H), 1.70-1.90 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.72 (brs, 2H), 6.87 (s, 1H), 8.44 (brs, 1H).

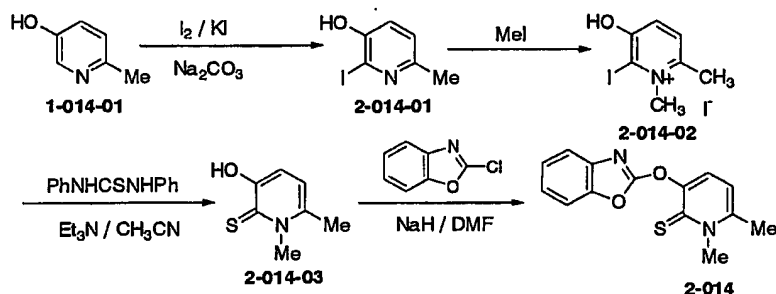
c) 1-ブチル-5,6-ジメチル-3-O-(ベンズオキサゾール-2-イル)-2-チオピリドン(2-004)の合成

実施例 1-004 と同様に行うことにより、2-004-02 (118 mg) から 1-ブチル-5,6-ジメチル-3-O-(ベンズオキサゾール-2-イル)-2-チオピリドン (2-004) (84 mg, 45.9%) を得た。

融点: 185 - 187 °C

10

実施例 J



a) 2-ヨード-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(2-014-01)の合成

5-ヒドロキシ-2-メチルピリジン(1-014-01)(36.11 g)に炭酸ソーダ (68.0 g)および水(810 mL)を加え、室温で攪拌溶解した。ヨウ素(117 g)およびヨウ化カリウム(117 g)の水(810 mL)溶液を35分間で滴下した。析出した橙黄色の結晶をろ過、減圧乾燥して2-ヨード-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(2-014-01)(34.1 g, 43.9%)を得た。

融点: 187 - 190 °C

20 ^1H -NMR (300MHz, $\text{CDCl}_3 + \text{CD}_3\text{OD}$): δ 2.45 (s, 3H), 6.45 (d, $J = 6.9$ Hz, 1H), 7.02 (dd, $J = 6.6, 1.5$ Hz, 1H)

b) 3-ヒドロキシ-2-ヨード-1,6-ジメチルピリジニウム ヨーゾド (2-014-02)の合成

ガラス製の封管に 2-ヨード-3-ヒドロキシ-6-メチルピリジン(835 mg) およびヨードメタン(3 mL)を入れ、130℃で4時間さらに180℃で1時間加熱した。反応液を濃縮乾固して、3-ヒドロキシ-2-ヨード-1,6-ジメチルピリジニウム ヨージド(2-014-02)(1.42 g)を得た。

5 c) 1,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオピリドン(2-014-03)の合成

3-ヒドロキシ-2-ヨード-1,6-ジメチルピリジニウム ヨージド(2-014-02)(852 mg)およびトリエチルアミン(457 mg)のアセトニトリル(10 mL)溶液に、1,3-ジフェニルチオ尿素(517 mg)を加え2時間加熱還流した。濃縮後、

10 1,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオピリドン(2-014-03)(279 mg)を得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.47 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 6.53 (d, *J*=8.1Hz, 1H), 6.95 (d, *J*=8.1Hz, 1H), 8.35 (brs, 1H).

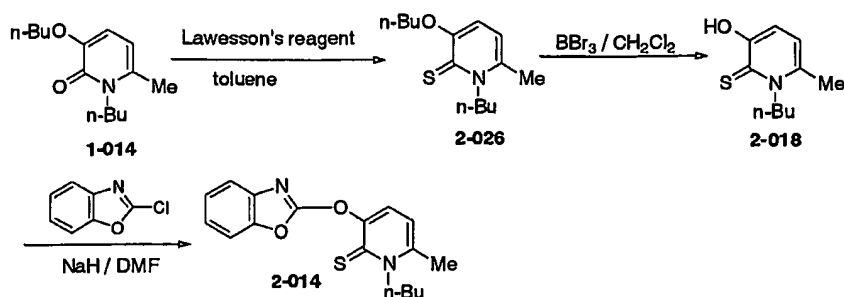
15 d) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-チオン(2-014)の合成

1,6-ジメチル-3-ヒドロキシ-2-チオピリドン(2-014-03)(157 mg)を DMF(3 mL)に溶かし、60%水素化ナトリウム(52 mg)を加え、室温で7分攪拌した。反応液に2-クロロベンゾオキサゾール(184 mg)をDMF(0.5 mL)で洗い入れ、室温で2時間攪拌した。飽和塩化アンモニア水溶液および酢酸エチルにて繰り返して抽出し、抽出液を濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製後、イソプロパノール/クロロホルムより再結晶を行い、3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-チオン(2-014)(182 mg, 66.8%)を得た。

融点: 245-247℃

25

実施例 K



a) 1-ブチル-3-ブチル-6-メチル-2-チオピリドン(2-026)の合成

1-ブチル-3-ブチル-2-ピリドン(1-014)(8.91 g)を乾燥トルエン(200 mL)に溶かし、ローソン試薬(19.41 g)を加え、窒素気流下3.5時間加熱還流した。反応液にメタノール(80 mL)を加え、室温で1.5時間攪拌後、反応液を濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(*n*-ヘキサン/酢酸エチル)で精製して、油状の1-ブチル-3-ブチル-6-メチル-2-チオピリドン(2-026)(12.97 g)を得、精製することなく次の反応に用いた。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ 0.94 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 0.99 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 1.46 (m, 4H), 1.87 (m, 4H), 2.50 (s, 3H), 3.98 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 4.75 (brs, 2H), 6.40 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.80 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H).

b) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-6-メチル-2-チオピリドン(2-018)の合成

1-ブチル-3-ブチル-6-メチル-2-チオピリドン(2-026)(12.97 g)を乾燥塩化メチレン(200 mL)に溶かし、1 mmol/mLの三臭化ホウ素/塩化メチレン溶液(5.6 mL)をゆっくりと加え、室温で5時間攪拌した。反応液を氷水(150 mL)に注ぎ入れ、濃アンモニアにてpH 8-9としクロロホルムで抽出、飽和食塩水にて洗浄、アルミナ(150 g)を充填したカラムを通した。クロロホルムにて溶出し、1-ブチル-3-ヒドロキシ-6-メチル-2-チオピリドン(2-018)(5.439 g, 73.4%)をオレンジ色の油状物として得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3): δ 1.02 (t, $J = 7.8\text{ Hz}$), 1.50 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.66 (brs, 2H), 6.49 (d, $J = 7.8\text{ Hz}$, 1H), 6.91 (d, $J = 7.8\text{ Hz}$, 1H), 8.44(brs, 1H).

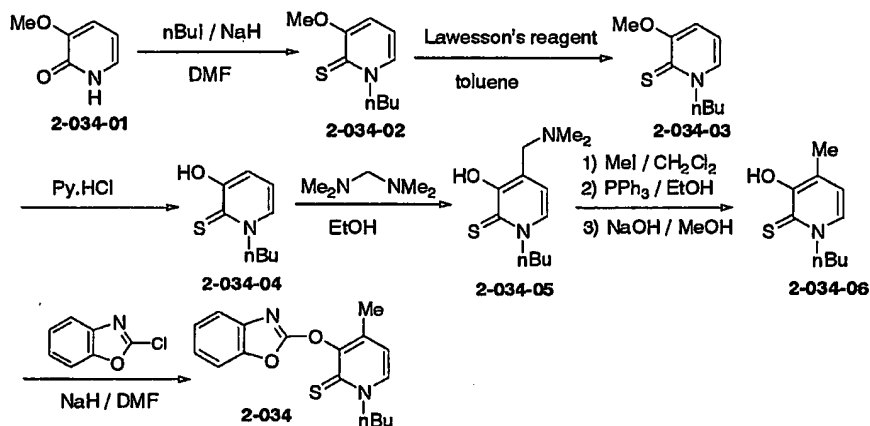
c) 1-ブチル-3-(ベンズオキサゾール-2-イルオキシ)-6-メチル-

2-チオピリドン(2-014)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-6-メチル-2-チオピリドン(2-018)(113 mg)を乾燥DMF(1.1 mL)に溶かし、この中に60%水素化ナトリウム(36 mg)を加えて室温で30分攪拌した。2-クロロベンゾオキサゾール(112 mg)を加え、2時間40分間攪拌した。反応液に氷水(20 mL)に加え、酢酸エチル(30 mL)で2回抽出し、飽和食塩水で洗浄し、濃縮した。残渣をクロロホルムを展開溶媒とした分取薄層クロマトグラフィーで精製後、エーテルより再結晶して1-ブチル-3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-6-メチル-2-チオピリドン(2-014)(117 mg)を得た。

10 融点：125-127.5℃

実施例 L



a) 1-ブチル-3-メトキシ-2-ピリドン(2-034-02)の合成

15 3-メトキシ-2-(1H)-ピリドン(2-034-01)(5.0 g)のDMF(40 ml)溶液に、室温で60%水素化ナトリウム(2.2 g)を加えた。20分攪拌後、1-ヨードブタン(15.5 g)を加え、さらに40分間攪拌した。水を加え、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い、20 無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー(トルエン/アセトン=4/1)で精製して、1-ブチル-

3-メトキシ-2-ピリドン(2-034-02) (6.7 g, 93%)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.93 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.30-1.42 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.97 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.09 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 6.59 (dd, $J = 7.2, 1.5$ Hz, 1H), 6.88 (dd, $J = 7.2, 1.5$ Hz, 1H).

5 b) 1-ブチル-3-メトキシピリジン-2-チオン(2-034-03)の合成

1-ブチル-3-メトキシ-2-ピリドン(2-034-02)(6.4 g)のトルエン(150 mL)溶液にローソン試薬 (16.8 g) を加え、加熱還流した。3時間攪拌後、室温でメタノール(100 mL)を加え、さらに30分攪拌した。減圧下で溶媒を留去後、水及び酢酸エチルを加え有機層を分離し、水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を、水及び飽和食塩水で洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去後、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン=4/1)で精製し、1-ブチル-3-メトキシピリジン-2-チオン(2-034-03) (5.6 g, 80%)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.98 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.84-1.94 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 4.62 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 6.61 (dd, $J = 7.9, 6.2$ Hz, 1H), 6.69 (dd, $J = 7.9, 1.2$ Hz, 1H), 7.38 (dd, $J = 6.2, 1.2$ Hz, 1H).

c) 1-ブチル-3-ヒドロキシピリジン-2-チオン(2-034-04)の合成

1-ブチル-3-メトキシピリジン-2-チオン(2-034-03)(1.4 g)にピリジン塩酸塩(3.6 g)を加えた。190℃で40分間攪拌後、水及び酢酸エチルを加え有機層を分離し、水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を、水及び飽和食塩水で洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、1-ブチル-3-ヒドロキシピリジン-2-チオン(2-034-04)(1.02 g, 78%)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.99 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.43 (m, 2H), 1.91 (m, 2H), 4.53 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 6.66 (dd, $J = 7.6, 6.7$ Hz, 1H), 6.97 (dd, $J = 7.6, 1.2$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 6.7, 1.2$ Hz, 1H), 8.61 (brs, 1H).

d) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-(N,N-ジメチルアミノメチル)ピリジ

ン-2-チオン(2-034-05)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシピリジン-2-チオン(2-034-04)(1.0 g)の10%含水エタノール(20 mL)溶液に、室温でN, N, N', N'-テトラメチルジアミノメタン(1.70 g)を加えた。75℃で24時間攪拌後、減圧下で溶媒を留去し、
 5 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-(N, N-ジメチルアミノメチル)ピリジン-2-チオン(2-034-05)(1.3 g, 95%)を油状物質として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.39-1.47 (m, 2H), 1.86-1.93 (m, 2H), 2.29 (s, 6H), 3.48 (s, 2H), 4.51 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 6.87 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 6.7 Hz, 1H).

10 e) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-メチルピリジン-2-チオン(2-034-06)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-(N, N-ジメチルアミノメチル)ピリジン-2-チオン(2-034-05)(1.0 g)の塩化メチレン(20 mL)溶液に室温でヨードメタン(2.1 g)を加えた。1時間攪拌後、減圧下で溶媒を留去した。残渣にエタノール
 15 (20 mL)、およびトリフェニルホスフィン(1.6 g)を加えた。75℃で20時間攪拌後、減圧下で溶媒を留去した。残渣にメタノール(10 mL)、及び1N水酸化ナトリウム水溶液(8 mL)を加え、60℃で2時間攪拌した。減圧下で溶媒を留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (トルエン/アセトン=4/1)で精製し、1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-メチルピリジン-2-チオン(2-034-
 20 06)(0.57 g, 70%)を油状物質として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.84-1.94 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 4.50 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.55 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H).

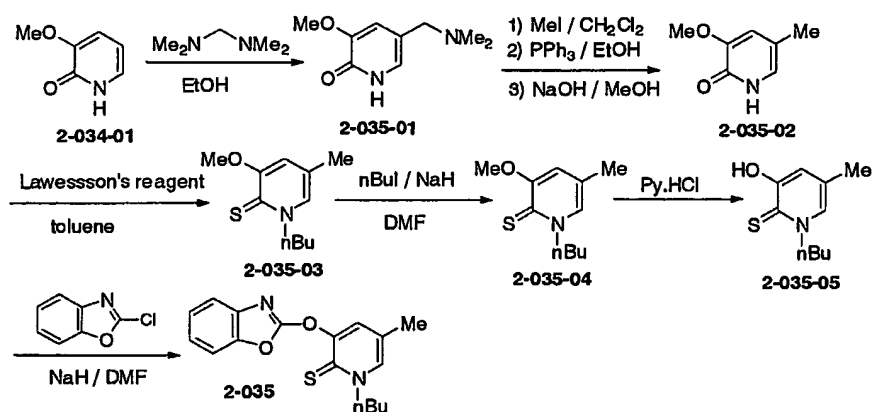
f) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ブチル-4-メチルピリジン-2-チオン(2-034)の合成
 25

1-ブチル-3-ヒドロキシ-4-メチルピリジン-2-チオン(2-034-06)(50 mg)のDMF(1.0 mL)溶液に、室温で60%水酸化ナトリウム(15 mg)を加え

た。20分間攪拌後、2-クロロベンゾオキサゾール(85 mg)を加え、さらに75℃
 で17時間攪拌した。水を加え、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム
 水溶液と酢酸エチルを加え有機層を分離した後、水層を酢酸エチルで3回抽出し
 5 した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー (ト
 ルエン/アセトン=4/1)で精製することにより3-(ベンゾオキサゾール-2-イ
 ルオキシ)-1-ブチル-4-メチルピリジン-2-チオン(2-034)(73 mg, 92%)
 を黄色結晶として得た。得られた結晶をさらに再結晶 (塩化メチレン/エーテル)
 により精製した。

10

実施例 M



a) 5-(N,N-ジメチルアミノメチル)-3-メトキシ-2-(1H)-ピリ
 ドン(2-035-01)の合成

15 3-メトキシ-2-(1H)-ピリドン(2-034-01)(5.0 g)の10%含水エタノー
 ル(150 mL)溶液に、室温でN,N,N',N'-テトラメチルジアミノメタン(54
 mL)を加え、加熱還流した。48時間攪拌後、減圧下で溶媒を留去し、得られた
 粗生成物をカラムクロマトグラフィー (クロロホルム/メタノール/水=6/4/1)
 で精製し、5-(N,N-ジメチルアミノメチル)-3-メトキシ-2-(1H)
 20 -ピリドン(2-035-01)(4.5 g, 53%)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 2.21 (s, 6H), 3.17 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 6.86 (d, J

= 1.8 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 1.8 Hz, 1H).

b) 3-メトキシ-5-メチル-2-(1H)-ピリドン(2-035-02)の合成

2-034-06と同様にして合成した(71%)。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.11 (d, J = 1.2 Hz, 3H), 3.84 (s, 3H), 6.62 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.1, 1.2 Hz, 1H).

c) 1-ブチル-3-メトキシ-5-メチル-2-ピリドン(2-035-03)の合成

2-034-02と同様にして合成した(63%)。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.94 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.29-1.42 (m, 2H), 1.66-1.76 (m, 2H), 2.08 (d, J = 1.2 Hz, 3H), 3.80 (s, 3H), 3.92 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 6.45 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 2.1, 1.2 Hz, 1H).

d) 1-ブチル-3-メトキシ-5-メチルピリジン-2-チオン(2-035-04)の合成

2-034-03と同様にして合成した(100%)。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.97 (t, J = 7.4 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.83-1.93 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 4.59 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 6.55 (s, 1H), 7.21 (s, 1H).

e) 1-ブチル-3-ヒドロキシ-5-メチルピリジン-2-チオン(2-035-05)の合成

2-034-04と同様にして合成した(76%)。

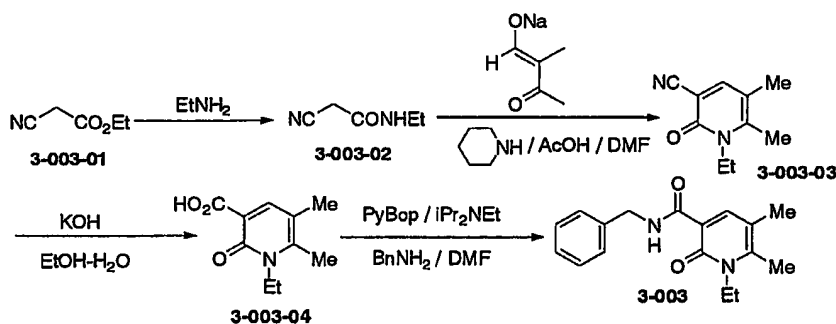
¹H-NMR (CDCl₃, 300 MHz): δ 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H), 1.85-1.95 (m, 2H), 2.19 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 4.49 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.86 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H).

f) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ブチル-5-メチルピリジン-2-チオン(2-035)の合成

1-ブチル-3-ヒドロキシ-5-メチルピリジン-2-チオン(2-035-05) (300 mg)のDMF (6.0 mL)溶液に、室温で60%水酸化ナトリウム(79 mg)を加えた。20分間攪拌後、2-クロロベンゾオキサゾール(432 mg)を加え、さらに室

温で2時間攪拌した。水を加え、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え有機層を分離した後、水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー（トルエン／アセトン=4/1）で精製し、3-（ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ）-1-ブチル-5-メチルピリジン-2-チオン(2-035)(372 mg, 78%)を黄色結晶として得た。得られた結晶をさらに再結晶（塩化メチレン／エーテル）により精製した。

10 実施例 N



a) N-エチル シアノアセタミド(3-003-02)

エチルシアノアセタート(3-003-01)(11.31g)に室温攪拌下、70%エチルアミン水溶液(15.5 mL)を滴下した。この時、内温が44℃に上昇したので、水冷攪拌し15分間を要し32～37℃で行った。そのまま9時間攪拌後、一晚室温放置した。反応液を減圧留去し、得られた褐色結晶性残渣(11.93 g)にエーテル(20 mL)とn-ヘキサン(10 mL)を加え、ろ取して、N-エチル シアノアセタミド(3-003-02)(9.05g, 80.7%)をオレンジ色結晶として得た。

融点：54－59℃

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.20 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.31-3.40 (m, 4H), 6.22 (brs, 1H).

b) 1-エチル-3-シアノ-5, 6-ジメチル-2-ピリドン(3-003-03)の合

成

2-メチル-3-オキソブタナール ナトリウム塩(3.18 g)とN-エチル シア
ノアセタミド(3-003-02)(2.243 g)をDMF(20 mL)に懸濁し、室温攪拌下、酢酸
(1.49ml)、続いてピペリジン(0.40 mL)を加え、135℃油浴中で攪拌還流を行っ
5 た。5時間後、反応液にクロロホルムと水を加え、クロロホルムで3回抽出し、
硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた結晶性残渣(4.07g)をn-
ヘキサン(15 mL)で3回洗浄し、1-エチル-3-シアノ-5,6-ジメチル-
2-ピリドン(3-003-03)(3.38 g, 96%)を褐色結晶として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.33 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.43 (s, 3H),
10 4.19 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 7.59 (s, 1H).

c) 1-エチル-3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(3-003-04)
の合成

1-エチル-3-シアノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(3-003-03)(3.37 g)
を80%エタノール(65 mL)に溶解し、水酸化カリウム(7.96 g)を加え、窒素気流
15 中、102℃油浴中で攪拌還流を行った。24時間後、反応液を減圧濃縮し、水
(50 mL)と酢酸エチル(50 mL)を加え、氷冷攪拌後、振とう分液した。水層に氷冷
下、濃塩酸(13 mL)を加え入れ、析出した結晶をろ取し、冷水で洗浄して、1-
エチル-3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(3-003-04)(2.734 g,
73.3%)を黄土色結晶として得た。

20 融点: 164-165℃

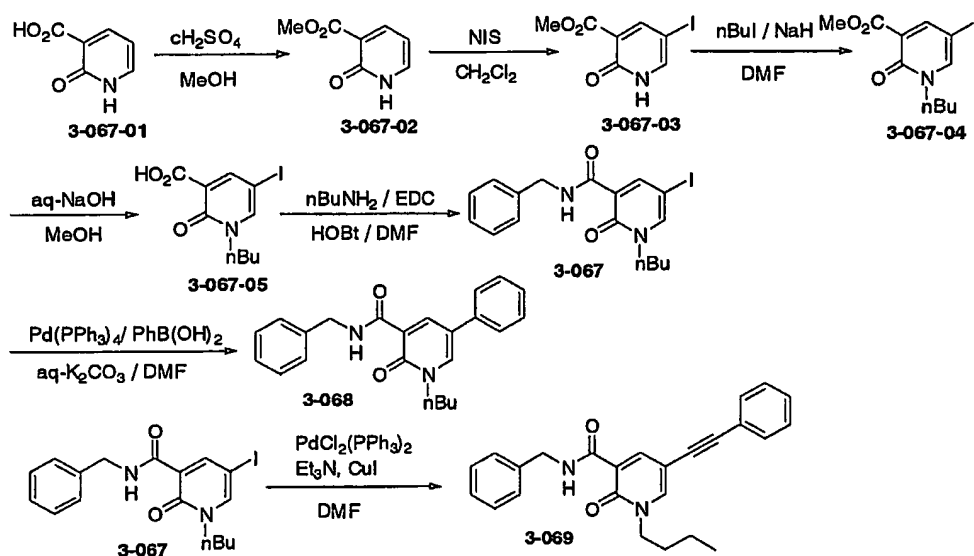
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 1.38 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.49 (s, 3H),
4.28 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 8.28 (s, 1H), 14.73 (brs, 1H).

d) 1-エチル-2-オキソ-5,6-ジメチル-1,2-ジヒドロピリジン-
3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-003)

25 1-エチル-3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(3-003-04)
(195 mg)をDMF(3 mL)に溶解し、ベンジルアミン(0.17 mL)、ジイソプロピル
エチルアミン(0.35 mL)、次いでベンゾトリアゾール-1-イルートリス(ピロジ

リノ) ホスホニウム ヘキサフルオロホスファート(PyBOP, 624 mg)を加え、室温で攪拌した。1時間後、反応液を酢酸エチルで希釈し、塩酸水溶液で2回洗浄し、続いて重曹水溶液で2回洗浄し、更に水洗1回行い、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。残渣(0.40 g)をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(30' g, クロロホルム)を行い、1-エチル-2-オキソ-5, 6-ジメチル-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-003)の結晶(259 mg, 91.1%)を得、塩化メチレン/n-ヘキサンで再結晶し、無色針状晶(207 mg, 72.9%)を得た。融点: 117 °C

10 実施例 O



a) 2-ヒドロキシニコチン酸 メチルエステル(3-067-02)の合成

2-ヒドロキシニコチン酸(3-067-01)(50 g)のメタノール(500 mL)溶液に、室温で濃硫酸(15 mL)、及びトルエン(100 mL)を加えた。ディーンスターク還流管を取り付け、28時間攪拌後、炭酸カリウム水溶液を加え中和し、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液とクロロホルムを加え有機層を分離した後、水層をクロロホルムで3回抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去して、2-ヒドロキシニコチン酸メチルエステル(3-067-02)(46 g, 84%)を白色固体として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 3.92 (s, 3H), 6.45 (dd, *J* = 7.3, 6.4 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 6.4, 2.4 Hz, 1H), 8.29 (dd, *J* = 7.3, 2.4 Hz, 1H).

b) 2-ヒドロキシ-5-ヨードニコチン酸 メチルエステル(3-067-03)の合成

2-ヒドロキシニコチン酸 メチルエステル(3-067-02)(20 g)の塩化メチレン
5 (500 mL) 溶液に、室温でN-ヨードサクシンイミド(NIS, 38 g)を加え、加熱還流した。16時間攪拌した後、溶媒を留去し、残渣に酢酸エチル(200 mL)を加え、さらに2時間加熱還流した。不溶の固体を濾取し、2-ヒドロキシ-5-ヨードニコチン酸 メチルエステル(3-067-03)(30 g, 81%)を白色固体として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 3.97 (s, 3H), 8.33 (brs, 1H), 8.43 (d, *J* = 2.4 Hz, 1H).
10

c) 1-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 メチルエステル(3-067-04)の合成

2-034-02と同様にして合成した(89%)。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.96 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H), 1.31-1.44 (m, 2H),
15 1.69-1.79 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.94 (t, *J* = 7.4 Hz, 2H), 7.71 (d, *J* = 2.8 Hz, 1H), 8.24 (d, *J* = 2.8 Hz, 1H).

c) 1-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸(3-067-05)の合成

3-003-04と同様にして合成した(89%)。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.99 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H), 1.35-1.47 (m, 2H),
20 1.74-1.84 (m, 2H), 4.05 (t, *J* = 7.5 Hz, 2H), 7.83 (d, *J* = 2.7 Hz, 1H), 8.63 (d, *J* = 2.7 Hz, 1H), 14.13 (s, 1H).

d) 1-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-067)の合成

25 3-003と同様にして合成した(82%)。

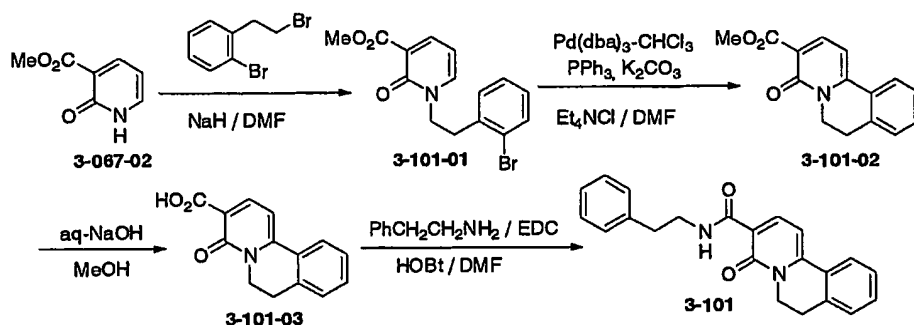
e) 1-ブチル-2-オキソ-5-フェニル-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-068)の合成

1-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カル
ボン酸 ベンジルアミド(3-067)(100 mg)のDMF (2.0 mL)溶液に、室温で
Pd(PPh₃)₄ (20 mg)、フェニルホウ酸(89 mg)及び2 M炭酸カリウム水溶液(0.24
5 mL)を加えた。90℃で18時間攪拌後、飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エ
チルを加え有機層を分離した。水層を酢酸エチルで3回抽出した後、合わせた有
機層を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減
圧下で留去し、得られた粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (トルエン/ア
セトン=7/1)で精製し、1-ブチル-2-オキソ-5-フェニル-1, 2-ジヒド
ロピリジン-3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-068)(77 mg, 88%)を油状物質と
10 して得た。

f) 1-ブチル-2-オキソ-5-フェニルエチニル-1, 2-ジヒドロピリジ
ン-3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-069)の合成

1-ブチル-5-ヨード-2-オキソ-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カル
ボン酸 ベンジルアミド(3-067)(78 mg)のDMF (2.0 mL)溶液に、室温で
15 PdCl₂(PPh₃)₂ (15 mg)、フェニルアセチレン(89 mg)、CuI (11 mg)、及びトリエ
チルアミン(48 mg)を加えた。90℃で18時間攪拌後、飽和塩化アンモニウム水
溶液と酢酸エチルを加え有機層を分離した。水層を酢酸エチルで3回抽出した後、
合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。
溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (トル
20 エン/アセトン=7/1)で精製することにより1-ブチル-2-オキソ-5-フェ
ニルエチニル-1, 2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸 ベンジルアミド(3-
068)(65 mg, 89%)を油状物質として得た。

実施例 P



a) 2-ヒドロキシー-1-(2-ブロモフェネチル)ニコチン酸 メチルエステル(3-101-01)の合成

2-034-02 と同様にして合成した(59%)。

- 5 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 3.25 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.23 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.09 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.08-7.23 (m, 4H), 7.56 (dd, $J = 8.1, 2.1$ Hz, 1H), 8.15 (dd, $J = 7.5, 2.4$ Hz, 1H).

b) 4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 メチルエステル(3-101-02)の合成

- 10 1-018-01 と同様にして合成した(42%)。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 3.01 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.35 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 6.76 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H), 7.32 (dd, $J = 7.3, 1.2$ Hz, 1H), 7.39 (ddd, $J = 7.6, 7.3, 1.5$ Hz, 1H), 7.46 (ddd, $J = 7.9, 7.6, 1.2$ Hz, 1H), 7.78 (dd, $J = 7.9, 1.5$ Hz, 1H), 8.25 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H).

- 15 c) 4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸(3-101-03)の合成

4-オキソ-6,7-ジヒドロピリド[2,1,a]イソキノリン-3-カルボン酸 メチルエステル(3-101-02)(252 mg)のジオキサン(2.0 mL)溶液に、室温で 2N 水酸化ナトリウム水溶液(2.0 mL)を加えた。1 時間攪拌後、反応液をエーテルで
20 洗浄し、濃塩酸で酸性にした。水及び酢酸エチルを加え有機層を分離した後、水層を酢酸エチルでさらに 3 回抽出し、合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、4-オキソ-6,

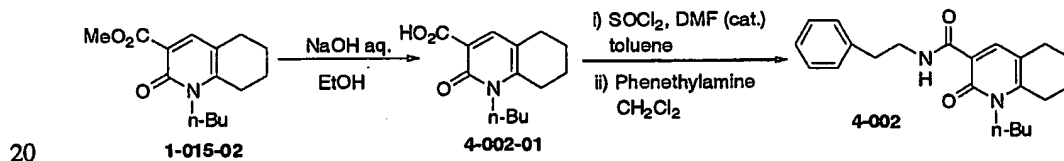
7-ジヒドロピリド[2, 1, a]イソキノリン-3-カルボン酸(3-101-03)(209 mg, 88%)を白色固体として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 3.10 (t, *J* = 6.7 Hz, 2H), 4.42 (t, *J* = 6.7 Hz, 2H), 7.05 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.36 (d, *J* = 7.3 Hz, 1H), 7.41-7.56 (m, 2H), 7.84 (d, *J* = 7.3 Hz, 1H), 8.56 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 14.40 (s, 1H).

d) 4-オキソ-6, 7-ジヒドロピリド[2, 1, a]イソキノリン-3-カルボン酸 フェネチルアミド(3-101)の合成

4-オキソ-6, 7-ジヒドロピリド[2, 1, a]イソキノリン-3-カルボン酸(3-101-03)(76 mg)のDMF (2.0 mL)溶液に、室温で1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩(EDC, 83 mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBt, 58 mg)、及びフェネチルアミン(80 mg)を加えた。18時間攪拌後、0.5 N塩酸で反応を停止し、酢酸エチルを加え有機層を分離した。水層を酢酸エチルでさらに3回抽出した後、合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下で溶媒を留去し、得られた粗結晶を再結晶して、4-オキソ-6, 7-ジヒドロピリド[2, 1, a]イソキノリン-3-カルボン酸 フェネチルアミド(3-101)(84 mg, 74%)を黄色結晶として得た。

実施例 Q



a) 1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸(4-002-01)の合成

1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸メチルエステル(1-015-02)(263 mg, 1 mmol)をエタノール(6 mL)に溶解し、水酸化ナトリウム水溶液(2M, 0.6 mL, 1.2 mmol)を加え、室温で30

分間攪拌した。反応液に 0.4 N 塩酸(6 mL)を加え酢酸エチル(25 mL)で抽出、水層はさらに食塩で塩析した後、酢酸エチル(25 mL)で抽出、有機層は合一して無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣をヘキサンから再結晶し、1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸(4-002-01)(220 mg, 88%)を白色結晶として得た。

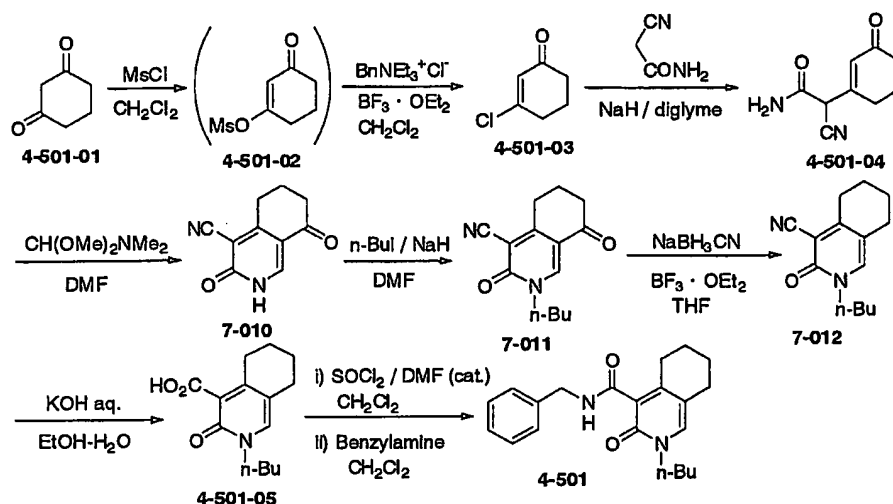
^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.46 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.68-1.73 (m, 2H), 1.77 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.92 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.65 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.80 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.10 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 8.22 (s, 1H), 14.82 (s, 1H).

b) 1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸 フェネチルアミド(4-002)の合成

1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸(4-002-01) (100 mg, 0.38 mmol)をトルエン(10 mL)に溶解し、塩化チオニル (83 μL , 1.14 mmol)と触媒量のDMFを加え、75°Cで30分間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を塩化メチレン(5 mL)に溶解した後、フェネチルアミン(143 μL , 1.14 mmol)を加え室温で10分間攪拌した。反応液に1 N 塩酸(10 mL)を加え酢酸エチル(30 mL)で抽出後、飽和食塩水(10 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、エーテルから再結晶して1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸 フェネチルアミド(4-002)(100 mg, 74%)を白色結晶として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.63 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.88 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.74 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.66 (dt, $J = 9.0$ Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.05 (brt, $J = 6.0$ Hz, 1H).

実施例 R



a) 3-クロロ-2-シクロヘキセン-1-オン(4-501-03)の合成

1, 3-シクロヘキサジオン(4-501-01)(8.72 g, 77.6 mmol)を塩化メチレン
 5 (400 mL)に溶解し、メタンスルホニルクロリド(6 mL, 77.6 mmol)と炭酸カリウ
 ム(32 g, 232 mmol)を加え、室温で2時間攪拌した。反応液を塩化メチレン(1.4 L)
 と水(400 mL)の混合液に加え分液し、有機層を飽和食塩水(400 mL)で洗浄後、無
 水硫酸マグネシウムで乾燥し全体量が300 mLになるまで減圧濃縮した。このメ
 シレート体(1)の塩化メチレン溶液に塩化ベンジルトリエチルアンモニウム(25 g,
 10 110 mmol)とボロントリフルオリドエチルエーテルコンプレックス(1.9 mL, 15.4
 mmol)を加え、室温で1.5時間攪拌した。反応液を塩化メチレン(0.8 L)と水(400
 mL)の混合液に加え分液し、有機層を飽和食塩水(400 mL)で洗浄後、無水硫酸マ
 グネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィ
 ー(トルエン/酢酸エチル)にて精製して3-クロロ-2-シクロヘキセン-1-
 15 オン(4-501-03)(7.24 g, 72%)を黄色油状物質として得た。

$^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3): δ 2.09 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.40 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.69 (td, $J = 6.0$ Hz, 1.5 Hz, 2H), 6.23 (t, $J = 1.5$ Hz, 1H).

b) 3-シアノアセタミド-2-シクロヘキセン-1-オン(4-501-04)の合成

2-シアノアセタミド(4.42 g, 52.8 mmol)をジグリム(50 mL)に溶解し、6

0 %水素化ナトリウム(2.1 g, 52.8 mmol)を加え室温で5分間激しく攪拌した。反応液に3-クロロ-2-シクロヘキセン-1-オン(4-501-03)(6.24 g, 48 mmol)のジグライム溶液(60 mL)を徐々に加え、室温で2.5時間攪拌し、さらに2-シアノアセタミド(1.6 g, 19.2 mmol)と60 %水素化ナトリウム (0.76 g, 19.2 mmol)を加え室温で1.5時間攪拌した。反応液に1 N塩酸(100 mL)を加え酢酸エチル(300 mL)で抽出した。水層はさらに食塩で塩析した後、酢酸エチル(300 mL)で抽出、有機層は合一して無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、ヘキサンから再結晶して3-シアノアセタミド-2-シクロヘキセン-1-オン(4-501-04)(6.5 g, 76%)を白色結晶として得た。

^1H NMR (300 MHz, d_6 -DMSO): δ 1.71 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 1.79 (quint, J = 6.0 Hz, 2H), 2.78 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 5.90 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 11.16 (brd, J = 1.5 Hz, 2H).

c) 3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-010)の合成

3-シアノアセタミド-2-シクロヘキセン-1-オン(4-501-04)(1.25 g, 7 mmol)をDMF(25 mL)に溶解しN, N'-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール(1.1 mL, 8.4 mmol)を加え室温で70時間攪拌した。反応液に1 N塩酸(100 mL)を加え酢酸エチル(300 mL)で抽出した。水層はさらに食塩で塩析した後、酢酸エチル(300 mL)で抽出、有機層は合一して無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた結晶性残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、トルエンから再結晶して3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-010)(0.92 g, 70%)を淡褐色結晶として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3 + (a small amount of CD_3OD)): δ 2.17 (quint, J = 6.3 Hz, 2H), 2.63 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 3.09 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 8.34 (s, 1H).

d) 2-ブチル-3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイ

ソキノリン-4-カルボニトリル(7-011)の合成

3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-010)(770 mg, 4.1 mmol)をDMF(15 mL)に溶解し、1-ヨードブタン(0.51 mL, 4.5 mmol)と60%水素化ナトリウム(180 mg, 4.5 mmol)を加え、室温で3時間攪拌した。反応液に1N希塩酸(60 mL)を加え酢酸エチル(150 mL)で抽出後、飽和食塩水(50 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮する。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-011)(610 mg, 61%)を白色結晶として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.38 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.76 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.15 (quint, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.61 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.06 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).

e) 2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-012)の合成

2-ブチル-3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-011)(100 mg, 0.41 mmol)をTHF(7 mL)に溶解し、ボロントリフルオリドエチルエーテル錯体(0.21 mL, 1.64 mmol)と水素化シアノホウ素ナトリウム(90 mg, 1.44 mmol)を加え、室温で30分間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(30 mL)を加え、酢酸エチル(60 mL)で抽出後、飽和食塩水(30 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-012)(70 mg, 74%)を白色粉末として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.67-1.86 (m, 6H), 2.54 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.87 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.22 (s, 1H).

f) 2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボン酸(4-501-05)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-012)(260 mg, 1.13 mmol)を水(6 mL)/エタノール
5 (26 mL)に溶解し、水酸化カリウム(444 mg, 7.91 mmol)を加え24時間加熱還流した。反応液を氷冷後、2 N塩酸(8 mL)を滴下し、酢酸エチル(70 mL)で抽出後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。結晶性残渣をヘキサンから再結晶して、2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボン酸(4-501-05)(197 mg, 70%)を白色結晶として得た。

10 ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.70-1.82 (m, 6H), 2.56 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.87 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.27 (s, 1H).

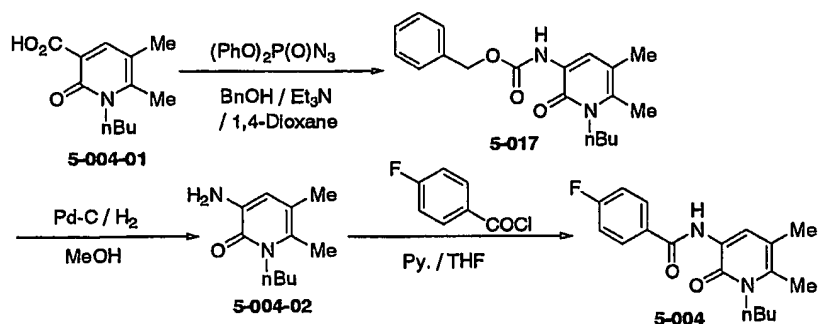
g) 2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボン酸 ベンジルアミド(4-501)の合成

15 2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボン酸(4-501-05)(5 mg, 0.02 mmol)をトルエン(1 mL)に溶解し、塩化チオニル(4.4 μL , 0.06 mmol)と触媒量のDMFを加え、75°Cで30分間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣を塩化メチレン(1 mL)に溶解した後、ベンジルアミン (6.2 μL , 0.06 mmol)を加え室温で10分間攪拌した。反応液に1 N塩酸
20 (3 mL)を加え酢酸エチル(8 mL)で抽出後、飽和食塩水(4 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボン酸 ベンジルアミド(4-501) (5 mg, 74%)を白色粉末として得た。

25 ^1H -NMR (CDCl_3 , 300 MHz): δ 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66-1.77 (m, 6H), 2.57 (brt, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.27 (brt, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.92 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.60 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.23-7.40 (m, 5H),

9.58 (brt, $J = 5.7$ Hz, 1H).

実施例 S



- 5 a) 3-ベンジルオキシカルボニルアミノ-1-ブチル-5, 6-ジメチル-2-ピリドン(5-017) の合成

1-ブチル 3-カルボキシ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(5-004-01)(2.233g)をジオキサ
ン(50 mL)に溶解し、トリエチルアミン(4.2 mL)、続いてジフェニルホスホリル
アシド(2.4 mL)を加え、窒素気流中、110℃油浴中で攪拌還流を行った。5時
10 間後、ベンジルアルコール(1.1 mL)を加え、同様に加熱攪拌を続けた。4時間後、
反応液を氷水中に注入し、酢酸エチル及び塩酸水溶液を加え、振とう分液後、重
曹水溶液、水洗を各1回行い硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られ
た残渣(3.56 g)をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ローバーカラム B, トル
エン/アセトン(29:1))を行い、3-ベンジルオキシカルボニルアミノ-1-ブチ
15 ル-5, 6-ジメチル-2-ピリドン(5-017)(2.477g, 75.4%) を黄色結晶として
得た。

融点: 65-66℃

- b) 3-アミノ-1-ブチル-5, 6-ジメチル-2-ピリドン(5-004-02) の合
成

20 3-ベンジルオキシカルボニルアミノ-1-ブチル-5, 6-ジメチル-2-
ピリドン(5-017)(2.487g)をメタノール(25 mL)に溶解し10%パラジウム炭素
(373 mg)の水(2.5mL)懸濁液を加え入れ、常圧にて接触還元を行った。4時間後、

反応液をセライト上で濾過し、メタノール洗浄し減圧留去して3-アミノ-1-ブチル-5,6-ジメチル-2-ピリドン(5-004-02)(1.438g, 97.8%)を褐色結晶として得た。

融点: 94-97℃

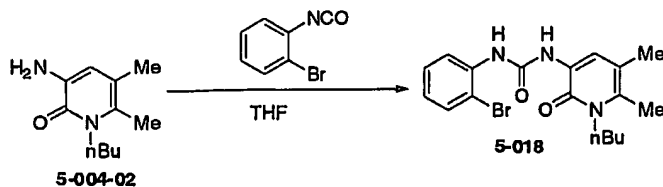
- 5 ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.97 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.60-1.71 (m, 2H), 4.08 (d, *J* = 7.8 Hz, 2H), 6.42 (s, 1H).

c) 1-ブチル-3-(4-フルオロベンゾイル)アミノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(5-004)の合成

- 3-アミノ-1-ブチル-5,6-ジメチル-2-ピリドン(5-004-02) (117
10 mg)をピリジン(1 mL)に溶解し、窒素気流中、氷冷攪拌下、4-フルオロベンゾ
イルクロリド(0.08 mL)のテトラヒドロフラン(1 mL)溶液を10分で滴下し、その
まま攪拌した。3時間後、反応液を酢酸エチルで希釈し、氷水中に注入し、酢酸
エチルで1回抽出した。塩酸水溶液、水洗、重曹水溶液、更に水洗を行い、硫酸
マグネシウムで乾燥後、減圧留去した。得られた結晶性残渣(202 mg)を塩化メチ
15 レン*n*-ヘキサンで再結晶を行い、無色針状晶の1-ブチル-3-(4-フルオロ
ベンゾイル)アミノ-5,6-ジメチル-2-ピリドン(5-004)(103 mg, 54.2%)
を得た。

融点 129-130℃

20 実施例 T



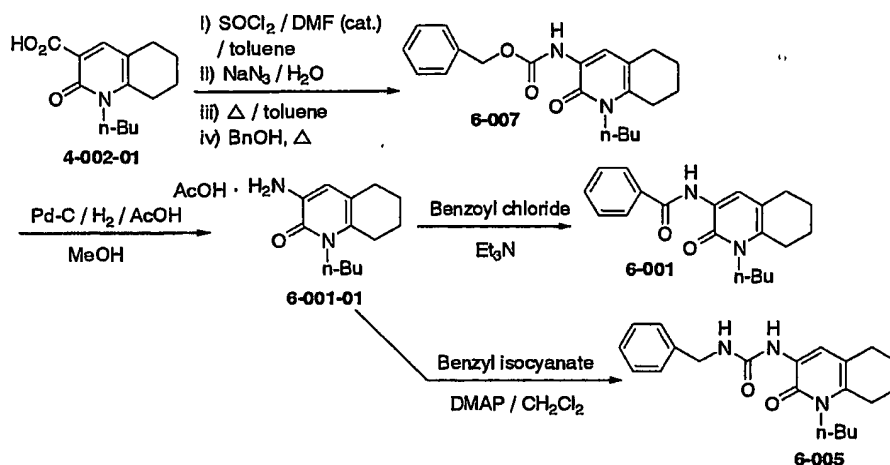
a) 4-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ベンジル-3-メトキシ-5,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-オン(5-018)

- 2-ブロモフェニルイソシアネート(80 mg)をテトラヒドロフラン(2 mL)に溶
25 解し窒素気流中、室温攪拌下、3-アミノ-1-ブチル-5,6-ジメチル-2

ーピリドン(5-004-02)(78 mg)のテトラヒドロフラン(2 mL)溶液を10分間で滴下し、一晚室温放置した。反応液を減圧留去し、得られた結晶をジクロルメタン／エーテルで再結晶し、4-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシ)-1-ベンジル-3-メトキシ-5,6-ジメチル-1*H*-ピリジン-2-オン(5-018)(142 mg, 89.9%)を得た。

融点：197-198°C

実施例U



10 a) (1-ブチル-2-オキソ-1,2-5,6,7,8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)カルバミン酸ベンジルエステル(6-007)の合成

1-ブチル-2-オキソ-1,2-5,6,7,8-ヘキサヒドロキノリン-3-カルボン酸(4-002-01)(100 mg, 0.38 mmol)をトルエン(5 mL)に溶解し、塩化チオニル(57 μ L, 0.76 mmol)と触媒量のDMFを加え、75°Cで30分間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をアセトン(5 mL)に溶解した後、アジ化ナトリウム(29 mg, 0.42 mmol)水溶液(0.5 mL)を加え室温で15分間撹拌した。反応液に水(5 mL)を加え、酢酸エチル(10 mL)で抽出後、飽和食塩水(5 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。残渣をトルエン(5 mL)に溶解し、120°Cで30分間撹拌後、ベンジルアルコール(46 μ L, 0.44 mmol)を加え、さらに
20 120°Cで2時間反応させた。反応液をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエ

ン/酢酸エチル)にて精製し、(1-ブチル-2-オキソ-1, 2-5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)カルバミン酸ベンジルエステル(6-007)(90 mg, 63%)を白色泡状物質として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.96 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.83 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.53 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.63 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 7.29-7.41 (m, 5H), 7.76 (s, 1H), 7.86 (brs, 1H).

b) 3-アミノ-1-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン 酢酸塩(6-001-01)の合成

(1-ブチル-2-オキソ-1, 2-5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)カルバミン酸ベンジルエステル(6-007)(100 mg, 0.28 mmol)をメタノール(7 mL)に溶解し、酢酸(16 μL, 0.28 mmol)と10%パラジウム炭素(30 mg)を加え、水素雰囲気下1.5時間激しく攪拌した。パラジウム炭素をろ過、母液を減圧濃縮した後、結晶性残渣をヘキサンから再結晶して3-アミノ-1-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン 酢酸塩(6-001-01)(60 mg, 76%)を白色結晶として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.98 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.05 (s, 3H), 2.58 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.67 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 8.27 (s, 1H).

c) N-(1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)ベンズアミド(6-001)の合成

3-アミノ-1-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン 酢酸塩(6-001-01)(5 mg, 0.018 mmol)を塩化メチレン(1 mL)に溶解し、ベンゾイルクロリド(2.3 μL, 0.02 mmol)とトリエチルアミン(5.6 μL, 0.04 mmol)を加え、室温で10分間攪拌した。反応液に0.1 N塩酸(3 mL)を加え酢酸エチル(10 mL)で抽出後、飽和食塩水(3 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し

減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエン/酢酸エチル)にて精製し、N-(1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)ベンズアミド(6-001)(4.9 mg, 83%)を白色泡状物質として得た。

5 ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.99 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.60 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 4.06 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 7.43-7.56 (m, 3H), 7.94 (d, *J* = 6.9 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.26 (brs, 1H).

d) 1-ベンジル-3-(1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)ウレア(6-005)の合成

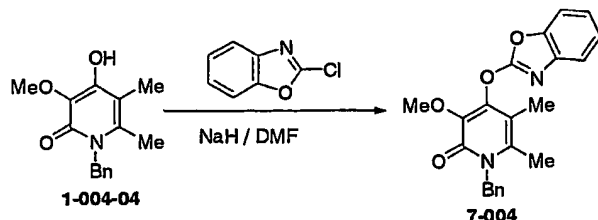
3-アミノ-1-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1*H*-キノリン-2-オン 酢酸塩(6-001)(5 mg, 0.018 mmol)を塩化メチレン(1 mL)に溶解し、ベンジルイソシアナート(2.5 μL, 0.02 mmol)と4-ジメチルアミノピリジン(2.4 mg, 0.02 mmol)を加え、室温で4時間攪拌した。反応液に0.1 N塩酸(3 mL)を加え

15 酢酸エチル(10 mL)で抽出後、飽和食塩水(3 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(トルエン/酢酸エチル)にて精製し、ヘキサンから再結晶して1-ベンジル-3-(1-ブチル-2-オキソ-1, 2, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロキノリン-3-イル)ウレア(6-005)(5.0 mg, 79%)を白色結晶として得た。

20 ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.92 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.32 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 2H), 1.69 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.82 (quint, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.55 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 2.59 (t, *J* = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 4.46 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 5.72 (brs, 1H), 7.24-7.32 (m, 5H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (brs, 1H).

25

実施例 V



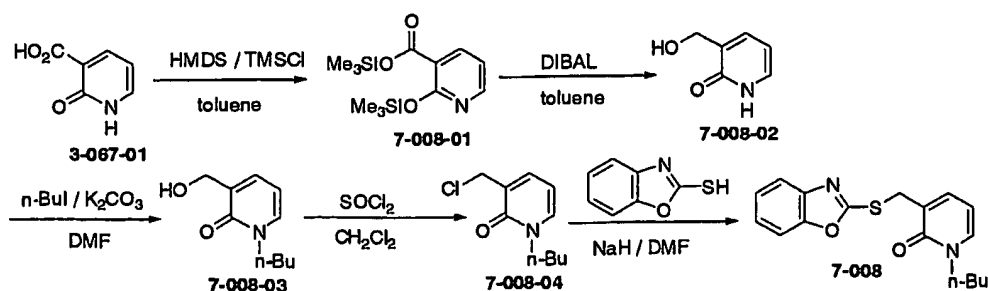
a) 1-(2-ブロモフェニル)-3-(1-ブチル-5,6-ジメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)ウレア(7-004)の合成

- 1-ベンジル-5,6-ジメチル-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2-ピリドン(1-004-04) (259 mg)をDMF(3 mL)に溶解し、窒素気流中、室温攪拌下、60%水素化ナトリウム(48 mg)を一時的に加え入れ、10分後2-クロロベンズオキサゾール(261 mg)のDMF(0.5 mL)溶液を加え、5時間攪拌後一晩室温放置した。反応混合物を氷水中に注入し、酢酸エチルエステルで2回抽出し、水洗2回後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧留去した。得られた結晶性残渣(278mg, 73.9%)をアセトン溶解し脱色炭処理後、エーテルを加え室温放置した。析出した結晶を濾取し、1-(2-ブロモフェニル)-3-(1-ブチル-5,6-ジメチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-イル)ウレア(7-004) (144 mg, 38.3%)を無色プリズム晶として得た。

融点 154~155°C

- ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 5.42 (brs, 2H), 7.19-7.54 (m, 9H).

実施例 W



- a) 3-ヒドロキシメチル-2-(1H)-ピリドン(7-008-01)の合成

2-ヒドロキシニコチン酸(3-067-01) (5.0 g)のトルエン(70 mL) 溶液に、室温でヘキサメチルジシラザン(HMDS, 19 mL)、及びクロロトリメチルシラン(TMSCl, 0.23 mL)を加え加熱還流した。2時間攪拌後、溶媒を留去し、残渣にトルエン(100mL)を加えた。次に、水素化ジイソブチルアルミニウム(DIBAL, 2M 5 トルエン溶液、90 mL)を -78°C で加え4時間攪拌後、メタノールを加えて反応を停止し、不溶物をセライトを用いて濾過した。減圧下で濾液を留去し、残渣に水と酢酸エチルを加え有機層を分離した後、水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、3-ヒドロキシメチル-2 (1H) -ピリドン(7-008-10 01)(2.6 g, 59%)を白色固体として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 4.50 (s, 2H), 6.43 (t, $J=6.7$ Hz, 1H), 7.33-7.36 (m, 1H), 7.64-7.67 (m, 1H).

b) 1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-2-ピリドン(7-008-02)の合成

3-ヒドロキシメチル-2 (1H) -ピリドン(7-008-01)(0.63 g)のDMF (15 15 mL)溶液に、室温で炭酸カリウム(1.4 g)および1-ヨードブタン(1.86 g)を加えた。 70°C で2時間攪拌した後、溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加え、有機層を分離した後、水層を酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機相を水、飽和食塩水で順次洗い、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下で留去し、得られた粗生成物をカラムクロマトグラフィー(トルエン 20 /アセトン=2/1)で精製することにより1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-2-ピリドン(7-008-02)(0.56 g, 61%)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.96 (t, $J=7.3$ Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.95 (t, $J=7.6$ Hz, 2H), 4.57 (s, 2H), 6.20 (t, $J=6.7$ Hz, 1H), 7.24 (dd, $J=6.7, 1.2$ Hz, 1H), 7.28-7.31 (m, 1H).

c) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシメチル)-1-ブチル-2-ピリドン(7-008-03)の合成

2-034-03と同様にして合成した(50%)。

d) 1-ブチル-3-クロロメチル-2-ピリドン(7-008-04)の合成

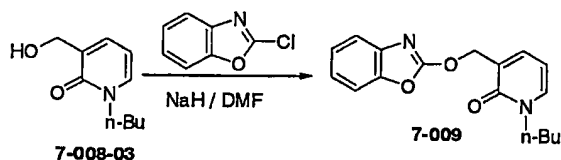
1-ブチル-3-ヒドロキシメチル-2-ピリドン(7-008-03)(169 mg)の塩化メチレン(4.0 mL)溶液に、室温で塩化チオニル(122 mg)を加えた。1時間攪拌した後、溶媒を留去し1-ブチル-3-クロロメチル-2-ピリドン(7-008-04)を油状物質として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.96 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.96 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 6.19 (t, $J = 6.7$ Hz, 1H), 7.27 (dd, $J = 6.7, 2.1$ Hz, 1H), 7.49-7.53 (m, 1H).

e) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルスルファニルメチル)-1-ブチル-2-ピリドン(7-008)の合成

2-035と同様にして合成した(97%)。

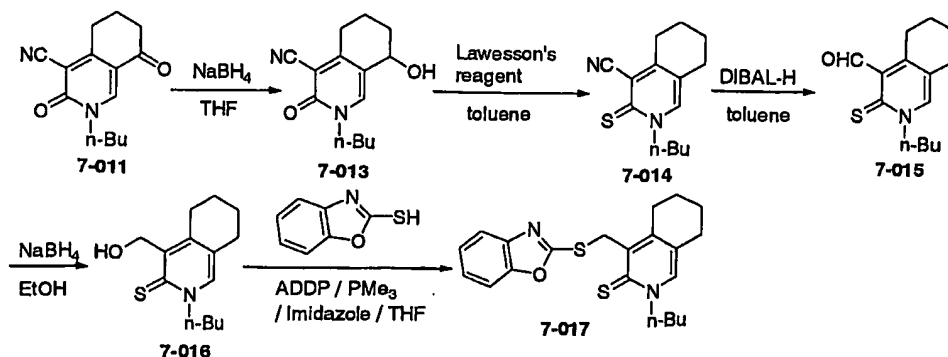
実施例 X



a) 3-(ベンゾオキサゾール-2-イルオキシメチル)-1-ブチル-2-ピリドン(7-009)の合成

2-035と同様にして合成した(50%)。

実施例 Y



a) 2-ブチル-8-ヒドロキシ-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-013)の合成

2-ブチル-3, 8-ジオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-011)(10 mg, 0.04 mmol)をTHF(1 mL)に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム(2.1 mg, 0.056 mmol)を加え、室温で10分間攪拌した。反応液に1N塩酸(3 mL)を加え酢酸エチル(10 mL)で抽出後、飽和食塩水(5 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた結晶性残渣を塩化メチレンから再結晶し、2-ブチル-8-ヒドロキシ-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-013)(7.4 mg, 75%)を白色結晶として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.38 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.76 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.15 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.06 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.45-3.58 (m, 1H), 4.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).

b) 2-ブチル-3-チオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-014)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-012)(80 mg, 0.35 mmol)をトルエン(8 mL)に溶解し、ローソン試薬(169 mg, 0.42 mmol)を加え、12時間加熱還流した。室温まで冷却後、メタノール(14 mL)を加え1時間室温で攪拌し、反応液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-チオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-014)(63 mg, 73%)を淡褐色粉末として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.75-1.90 (m, 6H), 2.60 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.87 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.81 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.50 (s, 1H).

c) 2-ブチル-3-チオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノ

ノリン-4-カルボアルデヒド(7-015)の合成

2-ブチル-3-チオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-014)(220 mg, 0.89 mmol)をトルエン(20 mL)に溶解し、氷冷下、水素化ジイソブチルアルミニウム(1 Mトルエン溶液, 1.7 mL, 1.7 mmol)を加え 30 分攪拌した。反応液に 1 N 希塩酸(5 mL)を加え、酢酸エチル(10 mL)で抽出後、飽和食塩水(10 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮する。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-チオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボアルデヒド(7-015)(44 mg, 20%)を淡褐色結晶として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.44 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 3.3$ Hz, 4H), 1.87 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.62 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.95 (brt, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.51 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.53 (s, 1H), 10.60 (s, 1H).

d) 2-ブチル-4-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8, -テトラヒドロ-2 H-イソキノリン-3-チオン(7-016)の合成

2-ブチル-3-チオキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボアルデヒド(7-015)(10 mg, 0.04 mmol)をメタノール(2 mL)に溶解し、水素化ホウ素ナトリウム(4.6 mg, 0.12 mmol)を加え室温で 10 分間攪拌した。反応液に 1 N 塩酸(4 mL)を加え酢酸エチル(10 mL)で抽出後、飽和食塩水(5 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製し、2-ブチル-4-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8, -テトラヒドロ-2 H-イソキノリン-3-チオン(7-016)(9 mg, 90%)を淡褐色粉末として得た。

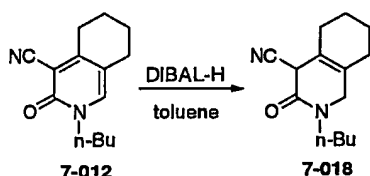
^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.71-1.95 (m, 6H), 2.66 (brt, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.83 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.58 (brt, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.79 (s, 2H), 7.61 (s, 1H).

e) 4-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオメチル)-2-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2*H*-イソキノリン-3-チオン(7-017)の合成

2-ブチル-4-ヒドロキシメチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2*H*-イソキノリン-3-チオン(7-016)(14 mg, 0.056 mmol)を THF(1 mL)に溶解し、
 5 2-メルカプトベンゾオキサゾール(16.3 mg, 0.11 mmol)、1, 1'- (アゾジカルボニル) ジピペリジン(28.1 mg, 0.11 mmol)、イミダゾール(7.6 mg, 0.11 mmol)、トリメチルホスフィン(1 Mトルエン溶液, 0.11 mL, 0.11 mmol)をそれぞれ加え、室温で18時間攪拌した。反応液を減圧濃縮しトルエン(2 mL)を加え析出してくる不溶物をろ過後、母液をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)で精製し、4-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオメチル)-2-ブチル-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2*H*-イソキノリン-3-チオン(7-017)(6.5 mg, 30%)を淡褐色粉末として得た。

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃): δ 0.99 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, *J* = 7.5 Hz, 2H), 1.70-1.95 (m, 6H), 2.62 (t, *J* = 6.3 Hz, 2H), 3.01 (t, *J* = 6.3 Hz, 2H), 4.58 (t, *J* = 7.5 Hz, 2H), 5.05 (s, 2H), 7.15-7.30 (m, 2H), 7.42 (dd, *J* = 7.2 Hz, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.48 (brs, 1H), 7.60 (dd, *J* = 7.2 Hz, *J* = 1.8 Hz, 1H).

実施例 Z



a) 2-ブチル-3-オキソ-1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8-オクタヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-018)の合成

2-ブチル-3-オキソ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-012)(100 mg, 0.43 mmol)をトルエン(10 mL)に溶解し、氷冷下、水素化ジイソブチルアルミニウム(1 Mトルエン溶液, 0.8 mL, 0.8 mmol)を加え10分間攪拌した。反応液に1 N塩酸(5 mL)を加え酢酸エチル(10

mL)で抽出後、飽和食塩水(5 mL)で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥し減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (トルエン/酢酸エチル)にて精製し、2-ブチル-3-オキソ-1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8-オクタヒドロイソキノリン-4-カルボニトリル(7-018)(70 mg, 70%)を白色粉末として得た。

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3): δ 0.93 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.32 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.42-1.59 (m, 5H), 1.88 (s, 1H), 1.97-2.08 (m, 2H), 2.20-2.32 (m, 1H), 2.54-2.66 (m, 1H), 3.06-3.19 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 3H).

- 10 上記実施例と同様にして、以下の表に示される化合物を合成した。なお、表中の左カラムの数字は化合物No.を表わす。

表 1

	構造式	物性値
I-1		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.13 (6H, s), 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.25 (3H, t, $J = 7.4$), 2.61 (2H, s), 3.05 (2H, s), 3.17 (1H, m), 3.64 (2H, q, $J = 6.9$), 6.72-6.80 (1H, m), 6.98-7.07 (2H, m), 7.20-7.32 (1H, m).
I-2		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.22 (3H, t, $J = 7.4$), 2.60 (2H, s), 2.95 (2H, q, $J = 7.4$), 2.96 (1H, q, $J = 6.9$), 3.73 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.10-7.17 (2H, m), 7.25-7.32 (1H, m).
I-3		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.16 (6H, s), 1.21 (6H, d, $J = 6.9$), 1.36 (3H, t, $J = 7.1$), 2.59 (2H, s), 3.17 (1H, q, $J = 6.9$), 3.65 (2H, s), 4.32 (2H, q, $J = 7.1$), 6.74-6.78 (1H, m), 7.12-7.16 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).
I-4		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.16 (6H, s), 1.21 (6H, d, $J = 6.9$), 1.36 (3H, t, $J = 7.1$), 2.63 (2H, s), 2.89 (2H, q, $J = 7.1$), 3.15 (1H, q, $J = 6.9$), 3.77 (2H, s), 6.79-6.85 (1H, m), 7.12-7.16 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).
I-5		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.23 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.11 (1H, q, $J = 6.9$), 4.51 (2H, s), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-6		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.20 (6H, d, $J = 6.9$), 1.30 (3H, t, $J = 7.4$), 2.90 (2H, t, $J = 7.4$), 3.15 (2H, t, $J = 7.4$), 3.20 (1H, q, $J = 6.9$), 4.31 (2H, t, $J = 7.4$), 6.79-6.82 (1H, m), 7.07-7.16 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-7		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.23 (6H, d, $J = 6.9$), 2.65 (3H, s), 2.90 (2H, t, $J = 7.4$), 3.20 (1H, q, $J = 6.9$), 4.45 (2H, t, $J = 7.4$), 6.79-6.82 (1H, m), 7.07-7.16 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).

表 2

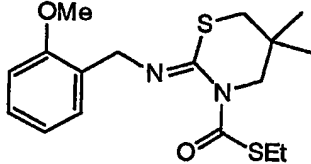
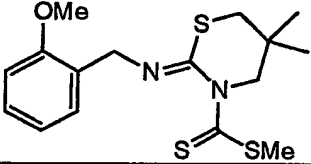
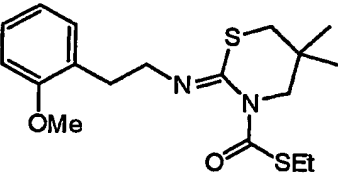
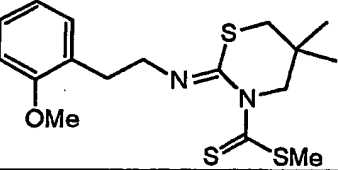
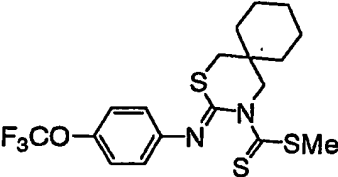
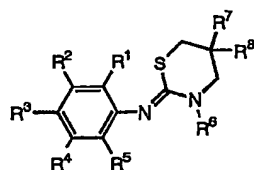
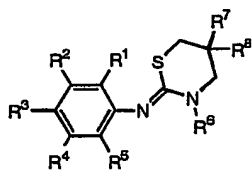
	構造式	物性値
I-8		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.15 (6H, s), 1.25 (3H, t, $J = 7.4$), 2.69 (2H, s), 2.83 (2H, q, $J = 7.4$), 3.69 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.61 (2H, s), 6.86 (1H, d, $J = 8.2$), 6.96 (1H, t, $J = 8.2$), 7.26 (1H, t, $J = 8.2$), 7.55 (1H, t, $J = 8.2$).
I-9		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.25 (6H, s), 2.56 (3H, s), 2.72 (2H, s), 3.85 (3H, s), 4.43 (2H, s), 4.63 (2H, s), 6.86-6.88 (2H, m), 7.20-7.30 (1H, m), 7.44-7.48 (1H, m).
I-10		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.11 (6H, s), 1.26 (3H, t, $J = 7.4$), 2.61 (2H, s), 2.83 (2H, q, $J = 7.4$), 2.99-3.05 (2H, m), 3.61-3.66 (2H, m), 3.62 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.86-6.91 (2H, m), 7.17-7.26 (2H, m).
I-11		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.19 (6H, s), 2.55 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.05 (2H, t, $J = 7.5$), 3.66 (2H, t, $J = 7.5$), 3.84 (3H, s), 4.35 (2H, s), 6.84-6.91 (2H, m), 7.17-7.30 (2H, m).
I-12		$^1\text{H-NMR}$ (δ ppm TMS / CDCl_3) 1.35-1.67 (8H, m), 1.74-1.86 (2H, m), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.56 (2H, s), 7.02-7.07 (2H, m), 7.22 (2H, d, $J = 8.2$ Hz).

表 3



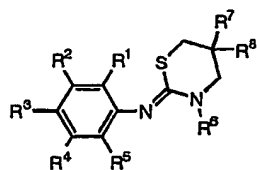
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-16	H	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-17	F	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-18	Cl	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-19	Me	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-20	Et	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-21	Pr	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-22	Bu	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-23	Bu ^s	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-24	Bu ^t	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-25	Ph	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-26	CF ₃	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-27	OMe	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-28	OEt	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-29	OPr'	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-30	SMe	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-31	SEt	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-32	SPr'	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-33	NMe ₂	H	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-34	H	Pr'	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-35	H	H	Cl	H	H	COSEt	Me	Me
I-36	H	H	Pr'	H	H	COSEt	Me	Me
I-37	H	H	NO ₂	H	H	COSEt	Me	Me
I-38	Me	Me	H	H	H	COSEt	Me	Me
I-39	Me	H	Me	H	H	COSEt	Me	Me
I-40	Me	H	H	Me	H	COSEt	Me	Me
I-41	Me	H	H	H	Me	COSEt	Me	Me
I-42	H	Me	Me	H	H	COSEt	Me	Me
I-43	H	Me	H	Me	H	COSEt	Me	Me
I-44	Me	H	Cl	H	H	COSEt	Me	Me

表 4



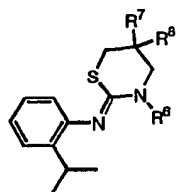
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-45	Cl	H	Me	H	H	COSEt	Me	Me
I-46	Pr'	H	NO ₂	H	H	COSEt	Me	Me
I-47	Pr'	H	H	H	NO ₂	COSEt	Me	Me
I-48	NO ₂	H	NO ₂	H	H	COSEt	Me	Me
I-49	Pr	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-50	Pr'	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-51	Bu ^o	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-52	H	Pr'	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-53	H	OMe	OMe	H	H	COSMe	Me	Me
I-54	H	-OCH ₂ O-		H	H	COSMe	Me	Me
I-55	H	OMe	OMe	OMe	H	COSMe	Me	Me
I-56	Et	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-57	Bu ^o	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-58	CH ₂ OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-59	CH(Me)OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-60	OMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-61	OEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-62	SMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-63	SEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-64	SPR'	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-65	SOMe	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-66	SO ₂ Me	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-67	SOEt	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-68	NMe ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-69	H	Pr'	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-70	H	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me

表 5



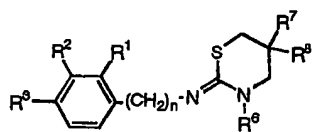
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-71	Me	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-72	Me	H	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-73	Me	H	H	H	Me	CSSMe	Me	Me
I-74	H	Me	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-75	H	Me	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-76	OMe	OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-77	H	OMe	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-78	OMe	H	H	OMe	H	CSSMe	Me	Me
I-79	OMe	H	OMe		H	CSSMe	Me	Me
I-80	H	-OCH ₂ O-		H	H	CSSMe	Me	Me
I-81	Pr'	H	NO ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
I-82	Pr'	H	H	H	NO ₂	CSSMe	Me	Me
I-83	H	OMe	OMe	OMe	H	CSSMe	Me	Me
I-84	Pr'	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-85	Bu ^s	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-86	OEt	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-87	SMe	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-88	H	Pr'	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-118	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-119	OMe	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-120	OMe	H	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-121	H	OMe	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-122	Me	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-123	N(Me)Ac	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me

表 6



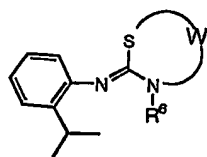
	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-89	COPr	Me	Me
I-90	COOMe	Me	Me
I-91	COOPr	Me	Me
I-92	CONHEt	Me	Me
I-93	COCH ₂ OMe	Me	Me
I-94	COCH ₂ SMe	Me	Me
I-95	COCH ₂ SEt	Me	Me
I-96	CSOEt	Me	Me
I-97	CSNHEt	Me	Me
I-98	CSSPr	Me	Me
I-99	CSSPr'	Me	Me
I-100	CSSBn	Me	Me

表 7



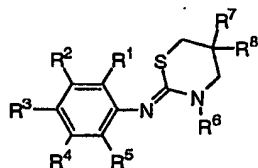
	R ¹	R ²	R ³	n	R ⁴	R ⁵	R ⁶
I-101	H	H	Cl	1	COSEt	Me	Me
I-102	H	H	Cl	1	CSSMe	Me	Me
I-103	Cl	H	Cl	2	COSEt	Me	Me
I-104	Cl	H	Cl	2	CSSMe	Me	Me

表 8



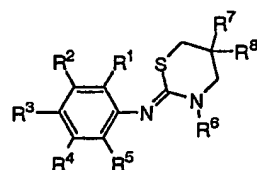
	R ⁶	W
I-105	COSEt	
I-106	COSEt	
I-107	COSEt	
I-108	COSEt	
I-109	COSEt	
I-110	COSEt	
I-111	COSEt	
I-112	COSEt	
I-113	CSSMe	
I-114	CSSMe	
I-115	CSSMe	
I-116	CSSMe	
I-117	CSSMe	

表 9



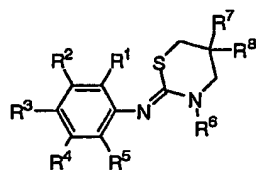
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-124	H	H	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-125	H	OEt	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-126	H	H	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-127	H	OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-128	H	OEt	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-129	H	OPr	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-130	H	OEt	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-131	H	H	OPr	H	H	CSSMe	Me	Me
I-132	H	OPr	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-133	H	H	OBu	H	H	CSSMe	Me	Me
I-134	H	OBu	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-135	H	OMe	OEt	H	H	CSSMe	Me	Me
I-136	H	OMe	OPr	H	H	CSSMe	Me	Me
I-137	H	OBu	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-138	H	H	OPr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
I-139	H	OPr ⁱ	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-140	H	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-141	F	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-142	Cl	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-143	H	Cl	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-144	Me	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-145	H	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-146	H	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-147	H	Bu	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-148	H	H	Bu	H	H	CSSMe	Me	Me

表 10



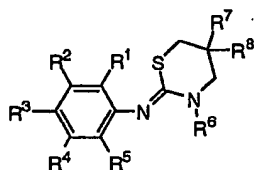
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-149	Bu ^t	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-150	H	H	Et	H	H	CSSMe	Me	Me
I-151	H	Et	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-152	H	H	F	H	H	CSSMe	Me	Me
I-153	H	F	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-154	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSMe	Me	Me
I-155	H	H	Morpho lino	H	H	CSSMe	Me	Me
I-156	H	Ac	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-157	H	H	Br	H	H	CSSMe	Me	Me
I-158	H	Br	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-159	Br	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-160	H	C(Me)= NOMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-161	H	H	Ac	H	H	CSSMe	Me	Me
I-162	H	H	C(Me)= NOMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-163	OPr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-164	Pr	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-165	CF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-166	H	H	OPh	H	H	CSSMe	Me	Me
I-167	H	H	Pr	H	H	CSSMe	Me	Me
I-168	H	H	Bu ^t	H	H	CSSMe	Me	Me
I-169	H	CF ₃	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-170	H	H	CF ₃	H	H	CSSMe	Me	Me
I-171	Pr ⁱ	H	NHAc	H	H	CSSMe	Me	Me
I-172	Pr ⁱ	H	H	H	NHAc	CSSMe	Me	Me
I-173	H	COOMe	H	H	OMe	CSSMe	Me	Me

表 1 1



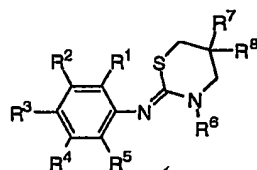
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-174	Morpholino	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-175	H	Morpholino	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-176	Pr ⁱ	H	H	COOEt	H	CSSMe	Me	Me
I-177	H	H	Piperidino	H	H	CSSMe	Me	Me
I-178	Pyrrolidino	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-179	H	SMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-180	H	H	SMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-181	OCF ₃	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-182	H	OCF ₃	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-183	H	H	OCF ₃	H	H	CSSMe	Me	Me
I-184	H	H	3-Pyridyl	H	H	CSSMe	Me	Me
I-185	H	3-Pyridyl	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-186	3-Pyridyl	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-187	OPh	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-188	H	OEt	OEt	H	H	COOMe	Me	Me
I-189	OMe	H	H	H	H	COOMe	Me	Me
I-190	H	H	Et	H	H	COOMe	Me	Me
I-191	H	H	Pr ⁱ	H	H	COOMe	Me	Me
I-192	OMe	H	H	H	H	COSMe	Me	Me
I-193	H	H	Et	H	H	COSMe	Me	Me
I-194	H	H	Pr ⁱ	H	H	COSMe	Me	Me
I-195	H	H	OEt	H	H	COSMe	Me	Me
I-196	H	OMe	OEt	H	H	COSMe	Me	Me
I-197	H	Piperidino	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-198	H	H	NEt ₂	H	H	CSSMe	Me	Me

表 1 2



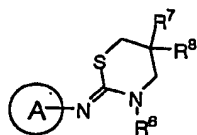
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-199	OMe	H	COOMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-200	H	2-Oxopyrrolidino	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-201	H	OPh	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-202	H	H	Ph	H	H	CSSMe	Me	Me
I-203	Ph	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-204	H	Ph	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-205	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSOMe	Me	Me
I-206	Pr ⁱ	H	I	H	H	CSSMe	Me	Me
I-207	OMe	H	(Morpholino)CO	H	H	CSSMe	Me	Me
I-208	H	H	NMe ₂	H	H	CSSMe	Me	Me
I-209	H	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-210	N(Me)Et	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-211	N(Me)Pr	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-212	NEt ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-213	F	H	H	H	F	CSSMe	Me	Me
I-214	Pr ⁱ	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
I-215	NMe ₂	Me	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-216	NMe ₂	H	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-217	NMe ₂	H	H	Me	H	CSSMe	Me	Me
I-218	NMe ₂	H	H	Cl	H	CSSMe	Me	Me
I-219	Me	H	H	H	Me	CSSMe	Me	Me
I-220	NMe ₂	H	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-221	H	NMe ₂	H	H	H	CSSEt	Me	Me
I-222	NMe ₂	H	Me	H	H	CSSEt	Me	Me
I-223	H	H	Pr ⁱ	H	H	CSSEt	Me	Me

表 1 3



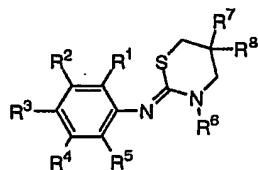
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-224	OMe	H	CONHMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-225	OCHF ₂	H	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-226	H	OCHF ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-227	H	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-228	NMe ₂	H	Cl	H	H	CSSMe	Me	Me
I-229	NMe ₂	H	F	H	H	CSSMe	Me	Me
I-230	NMe ₂	H	H	F	H	CSSMe	Me	Me
I-231	NMe ₂	H	Et	H	H	CSSMe	Me	Me
I-232	NMe ₂	H	H	Et	H	CSSMe	Me	Me
I-233	NMe ₂	H	Cl	H	H	CSSEt	Me	Me
I-234	NMe ₂	H	F	H	H	CSSEt	Me	Me
I-235	NMe ₂	H	Et	H	H	CSSEt	Me	Me
I-236	Pr ^I	H	H	H	H	CSSBu ^o	Me	Me
I-237	Pr ^I	H	H	H	H	CSSBu ^I	Me	Me
I-238	Pr ^I	H	H	H	H	CSNHMe	Me	Me
I-239	Me	NMe ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-240	NMe ₂	OMe	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-241	H	NMe ₂	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-242	NMe ₂	Cl	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-243	H	NMe ₂	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-244	Pr ^I	H	H	H	H	CSSEt	Et	Et
I-245	Pr ^I	H	H	H	H	Me	Me	Me
I-246	Pr ^I	H	H	H	H	Pr	Me	Me
I-247	Pr ^I	H	H	H	H	Pr ^I	Me	Me
I-248	Pr ^I	H	H	H	H	Bu ^I	Me	Me

表 1 4



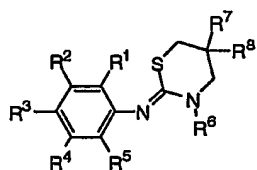
	A	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-249		CSSMe	Me	Me
I-250		CSSMe	Me	Me
I-251		CSSMe	Me	Me
I-252		CSSMe	Me	Me
I-253		CSSMe	Me	Me
I-254		CSSMe	Me	Me
I-255		CSSMe	Me	Me
I-256		CSSMe	Me	Me
I-257		CSSMe	Me	Me
I-258		CSSMe	Me	Me
I-259		CSSMe	Me	Me
I-260		CSSMe	Me	Me
I-261		CSSMe	Me	Me

表 1 5



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-262	NMe ₂	H	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-263	NMe ₂	H	H	OMe	H	CSSMe	Me	Me
I-264	Me	NEt ₂	H	H	H	CSSMe	Me	Me
I-265	H	NEt ₂	Me	H	H	CSSMe	Me	Me
I-266	H	NEt ₂	OMe	H	H	CSSMe	Me	Me
I-267	Bu ^s	H	H	H	H	CSSMe	Et	Et
I-268	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	Pr	Pr
I-269	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₄ -	
I-270	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₅ -	

表 1 6






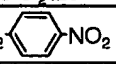
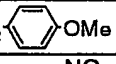
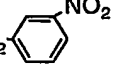
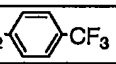
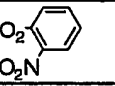
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
I-271	Pr ⁱ	H	H	H	H	SO ₂ Me	Me	Me
I-272	Pr ⁱ	H	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-273	Pr ⁱ	H	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-274	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-275	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ Et	Me	Me
I-276	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-277	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-278	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-279	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me
I-280	H	Pr ⁱ	H	H	H	SO ₂ 	Me	Me

表 1 7

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-16	57-59°C	1.16 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.64 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.3), 3.78 (2H, s), 6.96 (1H, dd, J = 7.4, 1.2), 7.14 (1H, t, J = 7.4), 7.36 (2H, t, J = 7.4).
I-17		1.15 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.67 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.3), 3.77 (2H, s), 7.10-7.15 (4H, m).
I-18		1.16 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.68 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3), 3.80 (2H, s), 6.96 (1H, dd, J = 7.7, 1.2), 7.08 (1H, dt, J = 7.7, 1.6), 7.25 (2H, t, J = 7.4), 7.40 (1H, d, J = 7.4).
I-19		1.15 (6H, s), 1.27 (3H, t, J = 7.3), 2.24 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.83 (1H, d, J = 7.7), 7.04 (1H, t, J = 7.7), 7.16-7.22 (2H, m).
I-20		1.15 (6H, s), 1.19 (3H, t, J = 7.4), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.62 (2H, q, J = 7.3), 2.65 (2H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.83 (1H, d, J = 7.6), 7.10-7.22 (3H, m).
I-21		0.95 (3H, t, J = 7.3), 1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 1.50-1.64 (2H, m), 2.56 (2H, q, J = 7.3), 2.59 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.82 (1H, d, J = 7.3), 7.06-7.28 (3H, m).
I-22		0.90 (3H, t, J = 7.1), 1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.30-1.34 (2H, m), 1.52-1.58 (2H, m), 2.54 (2H, q, J = 7.1), 2.62 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.79 (1H, dd, J = 7.9, 1.4), 7.06-7.28 (3H, m).
I-23		0.86 (3H, t, J = 7.4), 1.14 (6H, s), 1.16 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.48-1.58 (2H, m), 2.61 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 2.88-2.92 (1H, m), 3.76 (2H, d, J = 13.6), 3.82 (1H, d, J = 13.6), 6.82-6.88 (1H, m), 7.10-7.18 (1H, m), 7.23-7.29 (1H, m).
I-24		1.15 (6H, s), 1.27 (3H, t, J = 7.4), 1.33 (9H, s), 2.68 (2H, s), 2.86 (2H, q, J = 7.4), 3.75 (2H, s), 6.86 (1H, dd, J = 7.4, 1.6), 7.08-7.19 (2H, m), 7.38 (2H, dd, J = 7.4, 1.6).
I-25		0.99 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.45 (2H, s), 2.82 (2H, q, J = 7.4), 3.51 (2H, s), 6.98 (1H, d, J = 7.7), 7.20-7.36 (6H, m), 7.43 (2H, m).
I-26	82-83°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.3), 2.66 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.98 (1H, d, J = 7.6), 7.19 (1H, t, J = 7.6), 7.49 (1H, t, J = 7.6), 7.64 (1H, d, J = 7.6).

表 1 8

化合物 番号	物性	
	No	融点
NMR (CDCl ₃)		
I-27		1.16 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.62 (2H, s), 2.88 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.91-6.96 (3H, m), 7.05-7.14 (1H, m).
I-28		1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 1.40 (3H, t, J = 7.0), 2.60 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 4.08 (2H, q, J = 7.0), 6.90-6.94 (3H, m), 7.06-7.08 (1H, m).
I-29		1.14 (6H, s), 1.29 (6H, d, J = 7.4), 1.31 (6H, d, J = 6.0), 2.59 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 4.50 (1H, q, J = 6.0), 6.90-6.93 (3H, m), 7.01-7.07 (1H, m).
I-30	78-80°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.43 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.87-6.91 (1H, m), 7.05-7.14 (2H, m), 7.20-7.29 (1H, m).
I-31	55-57°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.91 (1H, dd, J = 7.4, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.4, 1.6).
I-32		1.15 (6H, s), 1.27 (6H, d, J = 6.6), 1.28 (6H, d, J = 7.4), 2.65 (2H, s), 2.88 (2H, q, J = 7.4), 3.38-3.42 (1H, m), 3.78 (2H, s), 6.90 (1H, dd, J = 7.7, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.7, 1.6).
I-33		1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.60 (2H, s), 2.71 (6H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.90-6.98 (3H, m), 7.05-7.10 (1H, m).
I-34		1.16 (6H, s), 1.27 (6H, d, J = 6.9), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.64 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 2.98 (1H, q, J = 6.9), 3.77 (2H, s), 6.78-6.83 (2H, m), 7.01-7.04 (1H, m), 7.25-7.27 (1H, m).
I-35	68-69°C	1.16 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.3), 2.66 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.3), 3.76 (2H, s), 6.98 (2H, dd, J = 6.6, 2.1), 7.31 (2H, dd, J = 6.6, 2.1).
I-36	67-69°C	1.15 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.26 (3H, t, J = 7.4), 2.64 (2H, s), 2.86 (2H, q, J = 7.4), 2.89 (1H, q, J = 6.9), 3.75 (2H, s), 6.98 (2H, d, J = 8.2), 7.20 (2H, d, J = 8.3).
I-37	125-126°C	1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.3), 2.72 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3), 3.78 (2H, s), 7.05 (2H, d, J = 8.3), 7.31 (2H, d, J = 8.3).
I-38	76-78°C	1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.14 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.70 (1H, d, J = 7.9), 6.94 (1H, d, J = 7.9), 7.06 (1H, s).

表 1 9

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-39		1.14 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.21 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.73 (1H, d, J = 7.9), 6.97 (1H, d, J = 7.9), 7.02 (1H, s).
I-40		1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.19 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.65 (1H, s), 6.86 (1H, d, J = 7.9), 7.07 (1H, d, J = 7.7).
I-41	59-61°C	1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.3), 2.19 (6H, s), 2.62 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.3), 3.78 (2H, s), 6.90-6.96 (1H, m), 7.02-7.08 (2H, m).
I-42		1.15 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.26 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.74 (1H, dd, J = 7.9, 1.8), 6.80 (1H, d, J = 1.8), 7.13 (1H, d, J = 7.7).
I-43		1.15 (6H, s), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.31 (6H, s), 2.63 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.58 (2H, s), 6.77 (1H, s).
I-44		1.15 (6H, s), 1.28 (3H, t, J = 7.4), 2.21 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.76 (2H, s), 6.74 (1H, d, J = 8.2), 7.10-7.18 (2H, m).
I-45		1.15 (6H, s), 1.28 (3H, t, J = 7.4), 2.31 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.74 (1H, d, J = 7.8), 7.04 (1H, d, J = 7.8), 7.25 (1H, d, J = 7.8).
I-46	119-120°C	1.16 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.69 (2H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.15 (1H, m), 3.79 (2H, s), 6.92 (1H, d, J = 8.7), 8.01 (1H, dd, J = 8.5, 2.4), 8.18 (1H, d, J = 2.4).
I-47		1.17 (6H, s), 1.23 (6H, d, J = 6.9), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.69 (2H, s), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 3.19 (1H, m), 3.79 (2H, s), 7.41 (1H, d, J = 8.7), 7.71 (1H, d, J = 2.4), 7.92 (1H, dd, J = 8.7, 2.4).
I-48		1.15 (6H, s), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.73 (2H, s), 2.93 (2H, q, J = 7.4), 3.82 (2H, s), 7.15 (2H, d, J = 8.3), 8.48 (1H, dd, J = 8.3, 1.4), 8.90 (1H, d, J = 8.3).
I-49	64-66°C	0.95 (3H, t, J = 7.3), 1.15 (6H, s), 1.50-1.64 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.56 (2H, q, J = 7.3), 2.63 (2H, s), 3.78 (2H, s), 6.82 (1H, d, J = 7.3), 7.06-7.28 (3H, m).
I-50	95-96°C	1.16 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 2.32 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.12 (1H, q, J = 6.9), 3.79 (2H, s), 6.78-6.82 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).

表 2 0

化合物 番号	物性	
	No	融点
NMR (CDCl ₃)		
I-51	53-56°C	0.85 (3H, t, J = 7.3), 1.15 (6H, d, J = 6.9), 1.18 (6H, s), 1.57-1.70 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.91 (1H, q, J = 6.9), 3.74 (1H, d, J = 13.7), 3.78 (1H, d, J = 13.7), 6.78-6.83 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.23-7.30 (1H, m).
I-52	88-90°C	1.17 (6H, s), 1.27 (6H, d, J = 6.9), 2.33 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.91 (1H, q, J = 6.9), 3.79 (2H, s), 6.78-6.83 (2H, m), 7.01-7.04 (1H, m), 7.20-7.24 (1H, m).
I-53		1.16 (6H, s), 2.32 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.77 (2H, s), 3.87 (6H, s), 6.51-6.59 (2H, m), 6.80-6.89 (1H, m).
I-54	102-104°C	1.15 (6H, s), 2.31 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.76 (2H, s), 5.96 (2H, s), 6.42 (1H, dd, J = 8.1, 1.8), 6.53 (1H, d, J = 1.8), 6.78 (1H, d, J = 8.1).
I-55	129-131°C	1.16 (6H, s), 2.32 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.78 (2H, s), 3.85 (6H, s), 3.86 (3H, s), 6.20 (2H, s).
I-56	107-109°C	1.17 (3H, t, J = 7.6), 1.22 (6H, s), 2.58 (2H, q, J = 7.6), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.91 (1H, dd, J = 7.5, 1.3), 7.02-7.19 (2H, m), 7.23-7.28 (1H, m).
I-57		0.85 (3H, t, J = 7.3), 1.18 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.57-1.70 (2H, m), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.88 (1H, q, J = 6.9), 4.38 (1H, d, J = 13.7), 4.60 (1H, d, J = 13.7), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-58	85-87°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.35 (3H, s), 4.40 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.93-6.99 (1H, m), 7.11-7.29 (2H, m), 7.40-7.49 (1H, m).
I-59	113-114°C	1.22 (3H, s), 1.24 (3H, s), 1.37 (3H, d, J = 6.4), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.24 (3H, s), 4.35 (1H, d, J = 13.6), 4.55 (1H, q, J = 6.4), 4.66 (1H, d, J = 13.6), 6.91 (1H, d, J = 7.4), 7.19-7.40 (2H, m), 7.51 (1H, d, J = 7.4).
I-60	128-130°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.85 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.93-6.99 (2H, m), 7.02-7.15 (2H, m).
I-61	100-101°C	1.26 (6H, s), 1.43 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.67 (3H, s), 4.08 (2H, q, J = 7.0), 4.55 (2H, s), 6.95-6.99 (3H, m), 7.11-7.18 (1H, m).
I-62	137-139°C	1.23 (6H, s), 2.43 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.53 (2H, s), 6.87-6.92 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.23-7.29 (1H, m).

表 2 1

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-63	103- 105°C	1.15 (6H, s), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.78 (2H, s), 6.91 (1H, dd, J = 7.4, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.4, 1.6).
I-64	125- 126°C	1.24 (6H, s), 1.28 (6H, d, J = 6.6), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.38-3.42 (1H, m), 4.53 (2H, s), 6.97 (1H, dd, J = 7.7, 1.6), 7.08-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J = 7.7, 1.6).
I-65		1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, d, J = 13.6), 2.75 (3H, s), 4.17 (1H, d, J = 13.6), 4.77 (1H, d, J = 13.6), 7.06 (1H, dd, J = 7.7, 1.7), 7.19-7.40 (2H, m), 7.97 (1H, dd, J = 7.7, 1.7).
I-66	147- 149°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.71 (2H, s), 3.13 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.11 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.23-7.29 (1H, m).
I-67	129- 130°C	1.22 (6H, s), 1.23 (3H, t, J = 6.9), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.70-2.85 (1H, m), 2.90-3.15 (1H, m), 4.25 (1H, d, J = 13.6), 4.70 (1H, d, J = 13.6), 7.06 (1H, d, J = 7.5), 7.30-7.45 (2H, m), 7.90 (1H, d, J = 7.5).
I-68	100- 102°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.71 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.93-6.99 (3H, m), 7.02-7.15 (1H, m).
I-69		1.23 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.92 (1H, q, J = 6.9), 4.52 (2H, s), 6.84-6.86 (2H, m), 7.08-7.13 (1H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-70	116- 118°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.97 (2H, d, J = 8.6), 7.35 (2H, d, J = 8.6).
I-71	103- 105°C	1.22 (6H, s), 2.19 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.79 (1H, d, J = 7.9), 6.98 (1H, d, J = 7.9), 7.02 (1H, s).
I-72	100- 101°C	1.23 (6H, s), 2.18 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.71 (1H, s), 6.88 (1H, d, J = 7.9), 7.08 (1H, t, J = 7.9).
I-73	93-95°C	1.22 (6H, s), 2.12 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 7.9), 6.98 (1H, d, J = 7.9), 7.08 (1H, t, J = 7.9).
I-74	126- 128°C	1.23 (6H, s), 2.25 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 7.9), 6.82 (1H, s), 7.13 (1H, d, J = 7.9).
I-75	96-98°C	1.23 (6H, s), 2.32 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.64 (2H, s), 6.80 (1H, s).
I-76		1.22 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.79 (3H, s), 3.88 (3H, s), 4.52 (2H, s), 6.60 (1H, d, J = 7.9), 6.73 (1H, d, J = 7.9), 7.04 (1H, d, J = 7.9).

表 2 2

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-77		1.24 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.87 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.61-6.65 (2H, m), 6.85-6.89 (1H, m).
I-78		1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.81 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.48 (1H, dd, J = 8.5, 2.4), 6.51 (1H, d, J = 2.4), 6.92 (1H, d, J = 8.5).
I-79		1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.77 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.56 (1H, d, J = 2.4), 6.68 (1H, dd, J = 8.5, 2.4), 6.86 (1H, d, J = 8.5).
I-80	108-110°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.49 (2H, s), 6.04 (2H, s), 6.50 (1H, dd, J = 8.1, 1.8), 6.61 (1H, d, J = 1.8), 6.83 (1H, d, J = 8.1).
I-81		1.23 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 2.65 (3H, s), 2.71 (2H, s), 3.11 (1H, q, J = 6.9), 4.51 (2H, s), 7.02 (1H, d, J = 8.5), 8.04 (1H, dd, J = 8.5, 2.7), 8.21 (1H, d, J = 2.7).
I-82		1.21 (6H, s), 1.24 (6H, d, J = 6.9), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.17 (1H, q, J = 6.9), 4.51 (2H, s), 7.45 (1H, d, J = 8.5), 7.80 (1H, d, J = 2.4), 7.99 (1H, dd, J = 8.5, 2.4).
I-83		1.24 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.85 (6H, s), 3.86 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.28 (2H, s).
I-84	68-70	1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 2.65 (2H, s), 3.11 (1H, q, J = 6.9), 3.25 (2H, q, J = 6.9), 4.48 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-85		0.85 (3H, t, J = 7.4), 1.18 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 1.57-1.70 (2H, m), 2.56 (2H, s), 2.87 (1H, q, J = 6.9), 3.25 (2H, q, J = 7.4), 4.35 (1H, d, J = 13.7), 4.60 (1H, d, J = 13.7), 6.89-6.92 (1H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-86	96-97	1.23 (6H, s), 1.36 (3H, t, J = 7.0), 1.40 (3H, t, J = 7.0), 2.63 (2H, s), 3.27 (2H, q, J = 7.4), 4.06 (2H, q, J = 7.0), 4.51 (2H, s), 6.92-7.08 (3H, m), 7.11-7.15 (1H, m).
I-87	105-106	1.22 (6H, s), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 2.43 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.26 (2H, q, J = 7.4), 4.50 (2H, s), 6.95-6.98 (1H, m), 7.10-7.17 (2H, m), 7.24-7.29 (1H, m).

表 2 3

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-88		1.23 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 6.9), 1.35 (3H, t, J = 7.4), 2.66 (2H, s), 2.90 (1H, q, J = 6.9), 3.28 (2H, q, J = 7.4), 4.50 (2H, s), 6.84-6.88 (2H, m), 7.08-7.13 (1H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-89		0.98 (3H, t, J = 7.4), 1.12 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.72-1.80 (2H, m), 2.58 (2H, s), 2.90 (2H, t, J = 7.4), 3.06 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, s), 6.71-6.76 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-90	99-101°C	1.14 (6H, s), 1.21 (6H, d, J = 6.9), 2.58 (2H, s), 3.14 (1H, q, J = 6.9), 3.64 (2H, s), 3.86 (3H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-91		1.00 (3H, t, J = 7.3), 1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.74 (2H, q, J = 7.3), 2.58 (2H, s), 3.16 (1H, q, J = 6.9), 3.65 (2H, s), 4.23 (2H, q, J = 6.9), 6.73-6.80 (1H, m), 7.12-7.18 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m).
I-92	52-53°C	1.13 (6H, s), 1.19 (6H, d, J = 6.9), 1.20 (3H, t, J = 7.4), 2.60 (2H, s), 2.98 (1H, q, J = 6.9), 3.38 (2H, q, J = 7.4), 3.77 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.09-7.18 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-93	76-78°C	1.14 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 2.62 (2H, s), 2.96 (1H, q, J = 6.9), 3.48 (3H, s), 3.75 (2H, s), 4.64 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.10-7.17 (2H, m), 7.25-7.32 (1H, m).
I-94	61-62°C	1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 2.23 (3H, s), 2.68 (2H, s), 2.93 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, s), 3.94 (2H, s), 6.82-6.86 (1H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).
I-95	50-52°C	1.13 (6H, s), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.31 (3H, t, J = 7.3), 2.65 (2H, J = 7.3), 2.68 (2H, s), 2.90 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, s), 3.97 (2H, s), 6.82-6.86 (1H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m).
I-96	73-75°C	1.21 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.42 (3H, t, J = 6.9), 2.61 (2H, s), 3.10 (1H, q, J = 6.9), 4.15 (2H, s), 4.65 (2H, q, J = 6.9), 6.74-6.78 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-97	160-162°C	1.18 (6H, s), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.60 (2H, s), 2.90 (1H, q, J = 6.9), 3.71 (2H, q, J = 7.4), 4.40 (2H, s), 6.74-6.78 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m).
I-98		1.04 (3H, t, J = 7.4), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.27 (6H, s), 1.73 (2H, m), 2.64 (2H, s), 3.12 (1H, q, J = 6.9), 3.22 (2H, t, J = 7.4), 4.48 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).

表 2 4

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-99	113- 114	1.04 (6H, d, J = 6.9), 1.27 (6H, s), 1.42 (3H, d, J = 6.9), 2.63 (2H, s), 3.14 (1H, q, J = 6.9), 4.02 (1H, q, J = 6.9), 4.46 (2H, s), 6.89-6.93 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-100		1.10 (6H, d, J = 6.9), 1.22 (6H, s), 2.64 (2H, s), 3.08 (1H, q, J = 6.9), 4.48 (2H, s), 4.49 (2H, s), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.20-7.38 (6H, m).
I-101		1.15 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.70 (2H, s), 2.87 (2H, q, J = 7.4), 3.69 (2H, s), 4.55 (2H, s), 7.30-7.40 (4H, m).
I-102		1.24 (6H, s), 2.57 (3H, s), 2.73 (2H, s), 4.43 (2H, s), 4.58 (2H, s), 7.23-7.40 (4H, m).
I-103		1.11 (6H, s), 1.26 (3H, t, J = 7.4), 2.61 (2H, s), 2.83 (2H, q, J = 7.4), 3.10 (2H, t, J = 7.4), 3.65 (2H, s), 3.66 (2H, t, J = 7.4), 7.17 (1H, dd, J = 8.2, 2.1), 7.30 (1H, t, J = 8.2), 7.36 (1H, d, J = 2.1).
I-104		1.16 (6H, s), 2.55 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.13 (2H, t, J = 7.5), 3.69 (2H, t, J = 7.5), 4.35 (2H, s), 7.15 (1H, dd, J = 8.2, 2.1), 7.25 (1H, t, J = 8.2), 7.36 (1H, d, J = 2.1).
I-105		1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.30 (3H, t, J = 7.4), 2.10-2.22 (2H, m), 2.88 (2H, t, J = 6.4), 2.94 (2H, q, J = 7.4), 3.11 (1H, q, J = 6.9), 4.05 (2H, t, J = 7.4), 6.82-6.86 (1H, m), 7.10-7.16 (2H, m), 7.28-7.34 (1H, m).
I-106		1.17-1.30 (12H, m), 1.45-1.52 (1H, m), 1.90-1.96 (1H, m), 2.92 (2H, q, J = 7.4), 2.95-3.05 (2H, m), 3.14-3.23 (1H, m), 3.72-3.75 (1H, m), 7.20-7.30 (2H, m), 7.40-7.45 (2H, m).
I-107		1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.28 (3H, d, J = 6.6), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.75-1.77 (1H, m), 2.29-2.34 (1H, m), 2.88 (2H, q, J = 7.4), 3.14 (1H, m), 3.31-3.36 (1H, m), 4.01-4.10 (2H, m), 6.81-6.85 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-108		1.12 (3H, d, J = 6.6), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 2.40-2.50 (1H, m), 2.57 (1H, dd, J = 13.5, 6.6), 2.91 (2H, q, J = 7.4), 2.95 (1H, m), 3.14 (1H, m), 3.45 (1H, dd, J = 13.5, 8.4), 4.30 (1H, dd, J = 13.5, 8.4), 6.81-6.85 (1H, m), 7.10-7.20 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).

表 2 5

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-109		0.88 (6H, t, J = 7.5), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.29 (3H, t, J = 7.4), 1.45-1.52 (4H, m), 2.58 (2H, s), 2.89 (2H, q, J = 7.4), 3.15 (1H, m), 3.77 (2H, s), 6.78-6.83 (1H, m), 7.08-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-110	109- 111°C	1.21 (6H, d, J = 6.9), 1.23 (6H, s), 1.25 (3H, t, J = 7.4), 2.81 (2H, q, J = 7.4), 2.90 (1H, t, J = 6.9), 3.05 (2H, s), 7.13-7.30 (2H, m), 7.36-7.45 (2H, m).
I-111		1.21 (6H, d, J = 6.9), 1.31 (3H, t, J = 7.4), 1.42 (3H, d, J = 6.7), 2.90 (2H, q, J = 7.4), 3.23 (1H, q, J = 6.9), 3.69 (1H, q, J = 6.6), 3.87-3.93 (1H, m), 6.78-6.82 (1H, m), 7.08-7.20 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-112		1.19-1.25 (9H, m), 1.14 (3H, d, J = 6.3), 2.76 (1H, d, J = 10.9), 2.96 (2H, t, J = 7.4), 3.22 (1H, q, J = 6.9), 3.44-3.48 (1H, m), 5.12 (1H, q, J = 6.3), 6.81-6.85 (1H, m), 7.09-7.16 (2H, m), 7.28-7.32 (1H, m).
I-113	126- 128°C	1.18 (6H, d, J = 6.9), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.45 (3H, t, J = 7.4), 1.80-1.91 (1H, m), 2.57-2.64 (2H, m), 2.61 (3H, s), 2.86-2.89 (1H, m), 3.07 (1H, m), 5.95-6.05 (1H, m), 6.98-7.00 (1H, m), 7.12-7.22 (2H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-114		1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.28 (3H, d, J = 6.9), 1.82-1.88 (1H, m), 2.48-2.63 (1H, m), 2.63 (3H, s), 3.11 (1H, m), 3.29-3.35 (1H, m), 4.26 (1H, m), 4.98 (1H, m), 6.90-6.95 (1H, m), 7.15-7.20 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-115		1.14 (3H, d, J = 6.5), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 2.53 (1H, dd, J = 13.0, 5.4), 2.75 (3H, s), 2.80-2.85 (1H, m), 2.95 (1H, dd, J = 13.0, 5.4), 3.11 (1H, m), 3.72 (1H, dd, J = 13.0, 9.0), 5.15 (1H, dd, J = 13.0, 9.0), 6.90-6.95 (1H, m), 7.15-7.25 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-116	119- 121°C	0.88 (6H, t, J = 7.5), 1.20 (6H, d, J = 6.9), 1.45-1.52 (4H, m), 2.62 (2H, s), 2.64 (3H, s), 3.15 (1H, m), 4.66 (2H, s), 6.78-6.83 (1H, m), 7.08-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).
I-117	99- 100°C	0.71-0.79 (1H, m), 0.85-0.90 (2H, m), 1.22 (6H, d, J = 6.9), 1.22-1.25 (1H, m), 2.61 (3H, s), 2.79 (3H, s), 3.00-3.05 (1H, m), 4.40 (2H, s), 6.92-6.95 (1H, m), 7.15-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).

表 2 6

化合物号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-118		1.23 (6H, s), 1.45 (6H, t, J = 7.4), 2.63 (3H, s), 2.67(2H,s), 4.08 (2H, q, J = 7.0), 4.55 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.85 (1H, d, J = 7.9).
I-119	116-118°C	1.24 (6H, s), 2.37 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.54 (2H, s), 6.75-6.80 (2H, m), 6.88 (1H, m).
I-120	92-93°C	1.23 (6H, s), 2.27 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.51-6.58 (2H, m), 7.10 (1H, d, J = 7.9).
I-121	129-130°C	1.22 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.80 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.78-6.95 (3H, m).
I-122	93-95°C	1.22 (6H, s), 2.12 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 7.9), 6.98 (1H, d, J = 7.9), 7.08 (1H, t, J = 7.9).
I-123	151-152°C	1.22 (6H, s), 1.83 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.17 (3H, s), 4.40 (1H, d, J = 13.6), 4.65 (1H, d, J = 13.6), 7.01 (1H, d, J = 7.9), 7.10-7.15 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).

表 2 7

化合物 番号	物性	
	No	融点
NMR (CDCl ₃)		
I-124	105-106°C	1.23 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.08 (2H, q, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.88 (2H, d, J=8.6), 6.98 (2H, d, J=8.6).
I-125	92-94°C	1.23 (6H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.08 (2H, q, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.70-6.75 (1H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-126	108-109°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.81 (3H, s), 4.50 (2H, s), 6.92 (2H, d, J=8.6), 7.04 (2H, d, J=8.6).
I-127	62-64°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.82 (3H, s), 4.50 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.70-6.75 (1H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-128	78-79°C	1.23 (6H, s), 1.44 (3H, t, J=7.0), 2.59 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.82 (3H, s), 4.10 (2H, q, J=7.0), 4.47 (2H, s), 6.57-6.63 (2H, m), 6.82-6.87 (1H, m).
I-129	58-60°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.00 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.87 (3H, s), 4.10 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.58-6.64 (2H, m), 6.86-6.91 (1H, m).
I-130		1.13 (6H, s), 1.45 (6H, t, J=7.4), 2.28 (3H, s), 2.62 (2H, s), 3.74 (2H, s), 4.08 (4H, q, J=7.4), 6.46-6.53 (2H, m), 6.88-6.92 (1H, m).
I-131	91-93°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.76 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.91 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.6), 6.98 (2H, d, J=8.6).
I-132	103-104°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.76 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.91 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.50 (1H, d, J=2.1), 6.60 (1H, d, J=7.4), 6.72 (1H, dd, J=7.4, 2.1), 7.28 (1H, d, J=7.4).
I-133	91-92°C	0.98 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.42-1.48 (2H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.96 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.6), 6.98 (2H, d, J=8.6).
I-134	86-87°C	0.98 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.42-1.48 (2H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.96 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.50 (1H, d, J=2.1), 6.60 (1H, d, J=7.8), 6.72 (1H, dd, J=7.8, 2.1), 7.28 (1H, d, J=7.8).

表 2 8

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-135	69-70°C	1.22 (6H, s), 1.47 (3H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.88 (3H, s), 4.15 (2H, q, J=7.0), 4.51 (2H, s), 6.61 (1H, d, J=8.2), 6.62 (1H, d, J=2.1), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-136	88-89°C	1.04 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.80 (2H, sext, J=7.0), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.90 (2H, t, J=7.0), 4.51 (2H, s), 6.61 (1H, dd, J=8.2, 2.1), 6.62 (1H, d, J=2.1), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-137	83-85°C	0.98 (3H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 1.42-1.48 (2H, m), 1.70-1.80 (2H, m), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.87 (3H, s), 4.03 (2H, t, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=8.2), 6.61 (1H, s), 6.88 (1H, d, J=8.2).
I-138	84-85°C	1.23 (6H, s), 1.34 (6H, d, J=6.1), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 4.53 (1H, sept, J=6.1), 6.89 (2H, d, J=8.6), 7.04 (2H, d, J=8.6).
I-139	92-93°C	1.23 (6H, s), 1.34 (6H, d, J=6.1), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 4.53 (1H, sept, J=6.1), 6.50 (1H, d, J=2.1), 6.60 (1H, d, J=8.0), 6.72 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.28 (1H, d, J=8.0).
I-140	109-110°C	1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 7.04 (2H, d, J=7.5), 7.15 (1H, d, J=7.5), 7.32 (2H, t, J=7.5).
I-141	92-93°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.01-7.08 (1H, m), 7.11-7.15 (3H, m).
I-142	133-135°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.03 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.08 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.25 (1H, t, J=8.0), 7.44 (1H, t, J=8.0).
I-143	92-93°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.88 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.03 (1H, d, J=2.1), 7.15 (1H, dd, J=8.0, 2.1), 7.28 (1H, t, J=8.0).
I-144	134-135°C	1.22 (6H, s), 2.22 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 7.00 (1H, d, J=8.1), 7.08 (1H, t, J=8.1), 7.15-7.25 (2H, m).
I-145	87-89°C	1.23 (6H, s), 2.37 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.82 (1H, d, J=8.1), 6.84 (1H, s), 6.98 (1H, d, J=8.1), 7.21 (1H, t, J=8.1).

表 2 9

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-146	91-93°C	1.23 (6H, s), 2.35 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.92 (2H, d, J=8.6), 7.15 (2H, d, J=8.6).
I-147	82-83°C	0.90 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.28-1.40 (2H, m), 1.48-1.55 (2H, m), 2.55 (2H, t, J = 7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.90 (1H, d, J=7.8), 7.09 (1H, t, J=7.8), 7.11 (1H, t, J=7.8), 7.28 (1H, d, J=7.8).
I-148	72-73°C	0.90 (3H, t, J=7.0), 1.22 (6H, s), 1.28-1.40 (2H, m), 1.48-1.55 (2H, m), 2.60 (2H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.95 (2H, d, J=8.6), 7.18 (2H, d, J = 8.6).
I-149	133-134°C	1.23 (6H, s), 1.35 (9H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=7.8), 7.13 (1H, t, J=7.8), 7.19 (1H, t, J=7.8), 7.41 (1H, d, J=7.8).
I-150	99-100°C	1.22 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.4), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.66 (2H, q, J=7.4), 4.50 (2H, s), 6.95 (2H, d, J= 8.6), 7.20 (2H, d, J=8.6).
I-151	40-42°C	1.23 (6H, s), 1.24 (3H, t, J=7.0), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.67 (2H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.83 (1H, d, J=8.1), 6.86 (1H, s), 7.00 (1H, d, J=8.1), 7.28 (1H, t, J=8.1).
I-152	118-119°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.97-7.10 (4H, m).
I-153	89-90°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.73-6.90 (3H, m), 7.25-7.30 (1H, m).
I-154	111-112°C	1.22 (6H, s), 1.25 (6H, d, J=7.0), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 4.50 (2H, s), 6.95 (2H, d, J=8.6), 7.25 (2H, d, J=8.6).
I-155	127-129°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.14-3.18 (4H, m), 3.85-3.90 (4H, m), 4.50 (2H, s), 6.93 (2H, d, J = 8.6), 7.04 (2H, d, J=8.6).
I-156	91-93°C	1.24 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.21-7.25 (1H, m), 7.48 (1H, t, J=7.9), 7.61 (1H, t, J=1.8), 7.74-7.78 (1H, m).

表 3 0

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-157	103.5-104.5°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.88-6.94 (2H, m), 7.46-7.51 (2H, m).
I-158	97-98°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.93-6.97 (1H, m), 7.19-7.31 (3H, m).
I-159	155.5-156.5°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 6.98-7.05 (2H, m), 7.28-7.34 (1H, m), 7.59-7.63 (1H, m).
I-160	102-106°C	1.23 (6H, s), 2.23 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.01-7.05 (1H, m), 7.28 (1H, t, J=1.8), 7.37 (1H, t, J=7.8), 7.45-7.49 (1H, m).
I-161	111-112°C	1.23 (6H, s), 2.60 (3H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.06-7.10 (2H, m), 7.97-8.03 (2H, m).
I-162	124-125°C	1.23 (6H, s), 2.23 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.00-7.05 (2H, m), 7.65-7.70 (2H, m).
I-163	102-103.5°C	1.23 (6H, s), 1.32 (6H, d, J=6.3), 2.63 (2H, s), 2.64 (3H, s), 4.52 (2H, s), 4.52 (1H, sept, J=6.3), 6.90-6.98 (3H, m), 7.04-7.13 (1H, m)
I-164	90-92°C	0.94 (3H, t, J=7.3), 1.23 (6H, s), 1.58 (2H, sext, J=7.3), 2.51-2.56 (2H, m), 2.65 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.90 (1H, dd, J=7.6, 1.3), 7.07-7.25 (3H, m)
I-165	157-158°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.49 (2H, s), 7.08 (1H, d, J=7.9), 7.22 (1H, d, J=7.6), 7.50-7.56 (1H, m), 7.66-7.69 (1H, m)
I-166	145-146°C	1.24 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.51 (2H, s), 7.00-7.13 (7H, m), 7.30-7.37 (2H, m)
I-167	77-79°C	0.95 (3H, t, J=7.3), 1.23 (6H, s), 1.65 (2H, sext, J=7.3), 2.58 (2H, t, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.93-7.00 (2H, m), 7.14-7.20 (2H, m)

表 3 1

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-168	117-118°C	1.23 (6H, s), 1.55 (9H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.96-7.01 (2H, m), 7.37-7.42 (2H, m).
I-169	55-56°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.19 (1H, d, J=7.6), 7.26-7.27 (1H, m), 7.40-7.52 (2H, m).
I-170	88-90°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.53 (2H, s), 7.10 (2H, d, J=8.2), 7.63 (2H, d, J=8.2).
I-171		1.15 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 2.17 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.78 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=8.2), 7.11-7.18 (1H, m), 7.28-7.35 (1H, m).
I-172		1.15 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 2.15 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.78 (2H, s), 6.99 (1H, s), 7.11-7.18 (1H, m), 7.28-7.35 (1H, s).
I-173	121-123°C	1.22 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.54 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=8.6), 7.67 (1H, d, J=2.1), 7.87 (1H, dd, J=8.6, 2.1).
I-174	146-147°C	1.24 (6H, s), 2.59 (2H, s), 2.65 (3H, s), 2.96-2.99 (4H, m), 3.76-3.79 (4H, m), 4.52 (2H, s), 6.98-7.17 (4H, m).
I-175	155-157°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.16-3.20 (4H, m), 3.84-3.88 (4H, m), 4.51 (2H, s), 6.54-6.57 (2H, m), 6.70-6.74 (1H, m), 7.24-7.30 (1H, m).
I-176		1.22 (6H, d, J=6.6), 1.23 (6H, s), 1.38 (3H, t, J=7.1), 2.65 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.08-3.18 (1H, m), 4.37 (2H, q, J=6.9), 4.52 (2H, s), 7.38 (1H, d, J=7.9), 7.59 (1H, d, J=2.0), 7.82 (1H, dd, J=8.1, 1.8).
I-177	120-122°C	1.23 (6H, s), 1.50-1.61 (2H, m), 1.67-1.75 (4H, m), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.13-3.17 (4H, m), 4.50 (2H, s), 6.92-7.02 (4H, m).
I-178	124-125°C	1.23 (6H, s), 1.85-1.90 (4H, m), 2.62 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.22-3.27 (4H, m), 4.48 (2H, s), 6.74-6.80 (2H, m), 6.95-6.98 (1H, m), 7.03-7.10 (1H, m).

表 3 2

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-179		1.23 (6H, s), 2.50 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.78-6.82 (1H, m), 6.91 (1H, t, J=2.0), 7.03-7.07 (1H, m), 7.25-7.31 (1H, m).
I-180	102-103°C	1.23 (6H, s), 2.49 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.96-7.01 (2H, m), 7.27-7.31 (2H, m).
I-181	82-83°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.52 (2H, s), 7.07 (1H, dd, J=7.6, 1.7), 7.14-7.20 (1H, m), 7.25-7.34 (2H, m).
I-182		1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.90 (1H, s), 6.93-7.04 (2H, m), 7.38 (1H, t, J=8.2)
I-183	68-70°C	1.24 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.51 (2H, s), 7.01-7.07 (2H, m), 7.21-7.24 (2H, m).
I-184	169-170°C	1.25 (6H, s), 2.66 (3H, s), 2.70 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.13-7.18 (2H, m), 7.34-7.39 (1H, m), 7.59-7.63 (2H, m), 7.86-7.91 (1H, m), 8.58 (1H, dd, J=4.8, 1.6), 8.87 (1H, t, J=1.5)
I-185	92.5-93.5°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.05-7.09 (1H, m), 7.24 (1H, t, J=1.6), 7.34-7.40 (2H, m), 7.49 (1H, t, J=7.6), 7.87-7.92 (1H, m), 8.60 (1H, dd, J=4.9, 1.4), 8.87 (1H, dd, J=2.3, 0.7)
I-186		1.09 (6H, s), 2.56 (3H, s), 2.58 (2H, s), 4.20 (2H, s), 7.09-7.12 (1H, m), 7.24-7.30 (2H, m), 7.36-7.45 (2H, m), 7.75-7.79 (1H, m), 8.54 (1H, dd, J=4.9, 1.6), 8.68 (1H, dd, J=2.3, 0.7)
I-187	110.5-111.5°C	1.17 (6H, s), 2.51 (3H, s), 2.61 (2H, s), 4.33 (2H, s), 6.93-7.19 (7H, m), 7.23-7.30 (2H, m)
I-188	75-76°C	1.14 (6H, s), 1.43 (6H, t, J=7.4), 2.61 (2H, s), 3.65 (2H, s), 3.84 (3H, s), 4.08 (4H, q, J=7.4), 6.46 (1H, dd, J=8.1, 2.2), 6.52 (1H, d, J=2.2), 6.84 (1H, d, J=8.4).
I-189		1.19 (6H, s), 2.61 (2H, s), 3.65 (2H, s), 3.85 (3H, s), 3.88 (3H, s), 6.85-6.99 (3H, m), 7.02-7.15 (1H, m).

表 3 3

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-190		1.13 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.4), 2.62 (2H, s), 2.66 (2H, q, J=7.4), 3.64 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.84 (2H, d, J=8.6), 7.16 (2H, d, J=8.6).
I-191	45-47°C	1.14 (6H, s), 1.25 (6H, d, J = 7.0), 2.62 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 3.64 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.86 (2H, d, J=8.6), 7.19 (2H, d, J=8.6).
I-192	93-95°C	1.15 (6H, s), 2.31 (3H, s), 2.62 (2H, s), 3.80 (2H, s), 3.85 (3H, s), 6.85-6.99 (3H, m), 7.02-7.15 (1H, m).
I-193	65-67°C	1.13 (6H, s), 1.23 (3H, t, J=7.4), 2.31 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.65 (2H, q, J=7.4), 3.77 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.3), 7.21 (2H, d, J=8.3).
I-194	95-97°C	1.15 (6H, s), 1.24 (6H, d, J=7.0), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 3.77 (2H, s), 6.90 (2H, d, J=8.6), 7.21 (2H, d, J=8.6).
I-195	94-96°C	1.15 (6H, s), 1.41 (3H, t, J=7.0), 2.31 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.77 (2H, s), 4.05 (2H, q, J=7.4), 6.90-6.99 (4H, m).
I-196	99-100°C	1.15 (6H, s), 1.47 (3H, t, J=7.0), 2.32 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.77 (2H, s), 3.88 (3H, s), 4.08 (2H, q, J=7.0), 6.52 (1H, d, J= 8.2), 6.56 (1H, d, J=2.1), 6.88 (1H, d, J=8.2) .
I-197	133-134°C	1.23 (6H, s), 1.50-1.75 (6H, m), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.18 (4H, t, J=5.4), 4.51 (2H, s), 6.47-6.57 (2H, m), 6.72-6.76 (1H, m), 7.21 (1H, d, J=8.1)
I-198	124-125°C	1.17 (6H, t, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.35 (4H, q, J=6.9), 4.49 (2H, s), 6.68 (2H, d, J=8.9), 7.04 (2H, d, J=8.9)
I-199	85-87°C	1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.92 (3H, s), 4.54 (2H, s), 7.01 (1H, d, J=7.9), 7.62 (1H, d, J=1.3), 7.67 (1H, dd, J=7.9, 1.7)
I-200	137-138°C	1.23 (6H, s), 2.11-2.22 (2H, m), 2.62 (2H, t, J=7.9), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.88 (2H, t, J=7.1), 4.52 (2H, s), 6.81-6.84 (1H, m), 7.30-7.50 (3H, m)

表 3 4

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-201	86.5- 87.5°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.67 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.71 (1H, t, J=2.0), 6.76-6.82 (2H, m), 7.02-7.13 (3H, m), 7.29-7.37 (3H, m)
I-202	162- 163°C	1.25 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.70 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.10-7.14 (2H, m), 7.33-7.46 (3H, m), 7.59-7.63 (4H, m)
I-203	56.5- 57.5°C	1.06 (6H, s), 2.51 (3H, s), 2.59 (2H, s), 4.14 (2H, s), 7.07 (1H, dd, J=8.2, 1.3), 7.21-7.45 (8H, m)
I-204	97-99°C	1.24 (6H, s), 2.65 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.00-7.04 (1H, m), 7.25-7.26 (1H, m), 7.33-7.48 (5H, m), 7.60-7.63 (2H, m)
I-205	95-96°C	1.21 (6H, s), 1.21 (6H, d, J=6.9), 2.61 (2H, s), 4.13 (3H, s), 4.16 (2H, s), 6.77-6.81 (1H, m), 7.13-7.16 (2H, m), 7.29-7.33 (1H, m)
I-206	128- 129°C	1.18 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.96-3.06 (1H, m), 4.48 (2H, s), 6.67 (1H, d, J=8.2), 7.47 (1H, dd, J=8.2, 1.7), 7.59 (1H, d, J=2.0)
I-207	149- 150°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.71 (8H, m), 3.86 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.95-7.05 (3H, m)
I-208	124- 126°C	1.23 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.67 (2H, s), 2.96 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.74 (2H, d, J=8.2), 7.04 (2H, d, J=8.2).
I-209	107- 109°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.96 (6H, s), 4.51 (2H, s), 6.34 (1H, d, J=2.0), 6.38 (1H, d, J=8.0), 6.54 (1H, dd, J=8.0, 2.0), 7.24 (2H, d, J=8.0).
I-210	98-99°C	1.06 (3H, t, J=7.4), 1.23 (6H, s), 2.63 (5H, s), 2.65 (3H, s), 2.99 (2H, q, J=7.4), 4.51 (2H, s), 6.98-7.10 (3H, m), 7.15-7.20 (1H, m).
I-211	94-96°C	0.84 (3H, t, J=7.4), 1.22 (6H, s), 1.49 (2H, sext, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.72 (3H, s), 2.84 (2H, t, J=7.4), 4.51 (2H, s), 6.90-7.05 (3H, m), 7.10-7.15 (1H, m).

表 3 5

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-212	98-99℃	1.02 (6H, t, J=7.4), 1.22 (6H, s), 2.61 (2H, s), 2.63 (3H, s), 3.06 (4H, q, J=7.4), 4.51 (2H, s), 6.98-7.10 (4H, m).
I-213	83-84℃	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.71 (2H, s), 4.57 (2H, s), 6.90-7.12 (3H, m)
I-214		1.19 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.06 (1H, sept, J=6.9), 4.49 (2H, s), 6.85 (1H, d, J=8.2), 7.14 (1H, dd, J=8.2, 2.3), 7.27 (1H, d, J=2.3)
I-215	83-85℃	1.23 (6H, s), 2.32 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.71 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.75-6.80 (1H, m), 6.98 (1H, s), 6.97-7.00 (1H, m).
I-216	99-100℃	1.23 (6H, s), 2.33 (3H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.78 (2H, t, J=7.9), 6.91 (1H, d , J=7.9).
I-217	98-99℃	1.23 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.67 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.81 (1H, s), 6.92 (2H, s).
I-218	117-19℃	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.68 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.89 (1H, d , J=8.5), 6.99 (1H, d , J=2.0), 7.04 (1H, dd , J=7.9, 2.0).
I-219	68-70℃	1.22 (6H, s), 2.22 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.54 (2H, s), 6.93-6.98 (1H, m), 7.04 (2H, d, J=8.0).
I-220	97-99℃	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.72 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.94-7.05 (3H, m), 7.15-7.20 (1H, m).
I-221	118-119℃	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.95 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.34 (1H, d, J=7.5), 6.38 (1H, s), 6.52 (1H, d, J=7.5,), 7.24 (1H, t, J=7.5).
I-222	74-76℃	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.33 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.78 (1H, d, J=7.5), 6.82 (1H, s), 6.91 (1H, t, J=7.5).

表 3 6

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-223		1.22 (6H, s), 1.25 (6H, d, J=7.0), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.65 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=7.0), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.50 (2H, s), 6.98 (2H, d, J=8.2), 7.28 (2H, d, J = 8.2).
I-224		1.21 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.97 (3H, d, J=4.9), 3.84 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.66 (1H, brs), 6.96 (1H, d, J=7.9), 7.30-7.33 (1H, m), 7.49 (1H, d, J=1.3)
I-225	69-71°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.49 (1H, t, J=74.6), 7.04-7.26 (4H, m)
I-226		1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.51 (2H, s), 6.50 (1H, t, J=74.2), 7.00-7.05 (2H, s), 7.11-7.16 (2H, m)
I-227	81-83°C	1.17 (6H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.35 (4H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.29 (1H, s), 6.30 (1H, d, t, J=8.2, 2.3), 6.49 (1H, dd, J=8.2, 2.3), 7.19 (1H, t, J=8.2).
I-228	106-107°C	1.21 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.47 (2H, s), 6.90 (2H, s), 6.93 (1H, s).
I-229	121-122°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.48 (2H, s), 6.50-6.70 (2H, m), 6.93 (1H, dd, J=8.5, 6.2).
I-230	85-86°C	1.21 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.66 (6H, s), 4.49 (2H, s), 6.74-6.79 (2H, m), 6.93-6.98 (1H, m).
I-231	82-84°C	1.23 (6H, s), 1.25 (3H, t, J=7.6), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 2.67 (2H, q, J=7.6), 2.71 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=7.6), 6.84 (1H, s), 6.93 (1H, d, J=7.6).
I-232	75-76°C	1.22 (3H, t, J=7.6), 1.23 (6H, s), 2.60 (2H, q, J=7.6), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.68 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.83 (1H, s), 6.93 (2H, s).
I-233	86-88°C	1.22 (6H, s), 1.33 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.71 (6H, s), 3.24 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.92 (2H, s), 6.94 (1H, s).

表 3 7

化合物 番号	物性	
	No	融点
NMR (CDCl ₃)		
I-234	70-71°C	1.22 (6H, s), 1.34 (3H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 2.71 (6H, s), 3.25 (2H, q, J=7.4), 4.46 (2H, s), 6.60-6.68 (2H, m), 6.92-6.94(1H, m).
I-235	80-82°C	1.22 (6H, s), 1.24 (3H, t, J=7.6), 1.33 (3H, t, J=7.4), 2.60 (2H, q, J=7.6), 2.61 (2H, s), 2.71 (6H, s), 3.24 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 6.81 (1H, d, J=7.6), 6.94(1H, s), 6.94 (1H, d, J=7.6).
I-236		1.03 (3H, t, J=7.3), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 1.40 (3H, d, J=6.9), 1.61-1.89 (2H, m), 2.63 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.95 (1H, q, J=6.9), 4.47 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
I-237		1.05 (6H, d, J=6.6), 1.21 (6H, d, J=6.6), 1.23 (6H, s), 1.98-2.08 (1H, m), 2.64 (2H, s), 3.16 (1H, sept, J=6.6), 3.20 (2H, d, J=6.6), 4.49 (2H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.13-7.22 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
I-238	102-104°C	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.61 (2H, s), 2.85-2.95 (1H, m), 3.19 (3H, d, J=4.6), 4.46 (2H, s), 6.73-6.79 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m), 12.40 (1H, brs)
I-239	58-60°C	1.23 (6H, s), 2.17 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.63 (1H, d, J=7.9), 6.87 (1H, d, J=7.9), 7.14 (1H, d, J=7.9).
I-240	100-101°C	1.23 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.78 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4.52 (2H, s), 6.60-6.70 (2H, m), 6.94 (1H, d, J=7.9).
I-241	82-83°C	1.23 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 4.52 (2H, s), 6.63 (1H, d, t, J=7.9, 1.9), 6.70 (1H, d, J=1.9), 7.14 (1H, d, J=7.9).
I-242	99-100°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 2.81 (6H, s), 4.50 (2H, s), 6.91 (1H, d, t, J=8.4, 2.6), 7.06 (1H, d, J=8.4), 7.14 (1H, d, J=2.6).
I-243	63-64°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 2.78 (6H, s), 3.89 (3H, s), 4.52 (2H, s), 6.67 (1H, s), 6.70 (1H, d, J=7.9), 6.81 (1H, d, J=7.9).
I-244	68-70°C	0.88 (6H, t, J=7.5), 1.22 (6H, d, J=6.9), 1.35 (3H, t, J=7.4), 1.50-1.70 (4H, m), 2.61 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.29 (2H, q, J=7.4), 4.44 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.08-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m).

表 3 8

化 合 物 番 号	物 性	
No	融 点	NMR (CDCl ₃)
I-245	81-82°C	1.14 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 2.63 (2H, s), 3.06 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.18 (3H, s), 6.74 (1H, dd, J=7.3, 1.7), 6.98-7.10 (2H, m), 7.20-7.24 (1H, m)
I-246	47-49°C	0.95 (3H, t, J=7.3), 1.13 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.55-1.74 (2H, m), 2.62 (2H, s), 3.03-3.11 (3H, m), 3.52-3.57 (2H, m), 6.73 (1H, dd, J=7.6, 1.7), 6.96-7.10 (2H, m), 7.21 (1H, dd, J=7.3, 1.7)
I-247	68-70°C	1.11 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 1.19 (6H, d, J=6.9), 2.56 (2H, s), 2.89 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 5.08 (1H, sept, J=6.9), 6.73 (1H, dd, J=7.9, 1.7), 6.99-7.10 (2H, m), 7.21 (1H, dd, J=7.9, 1.7)
I-248		0.97 (6H, d, J=6.9), 1.14 (6H, s), 1.18 (6H, d, J=6.9), 2.05-2.15 (1H, m), 2.62 (2H, s), 3.07 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (2H, d, J=7.6), 6.71 (1H, dd, J=7.6, 1.7), 6.96-7.09 (2H, m), 7.21 (1H, dd, J=7.6, 1.7)
I-249	96-97°C	1.23 (6H, s), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 4.59 (2H, s), 7.04 (1H, d, J=7.3), 7.41-7.50 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=7.3), 7.87 (1H, dd, J = 7.3, 2.1), 8.05 (1H, d, J=7.3,).
I-250	108-109°C	1.24 (6H, s), 2.67 (3H, s), 2.69 (2H, s), 4.59 (2H, s), 7.15 (1H, d, J=7.3), 7.41 (1H, q, J=7.3), 7.69 (1H, t, J=8.4), 7.91 (1H, d, J=7.3), 8.45 (1H, d, J=8.4), 8.92-8.95 (1H, m).
I-251	105-107°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.97 (3H, s), 4.53 (2H, s), 6.87-6.90 (1H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.96-7.99 (1H, m).
I-252	132-133°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.68 (2H, s), 2.92 (3H, s), 4.49 (2H, s), 6.73-6.78 (1H, m), 7.20-7.23 (1H, m), 8.05-8.07 (1H, m)
I-253	118-120°C	1.23 (6H, s), 2.60 (3H, s), 2.63 (2H, s), 4.52 (2H, s), 7.30 (2H, s), 8.12 (1H, s).
I-254	112-113°C	1.23 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.69 (2H, s), 3.94 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J = 8.1), 7.35 (1H, dd, J = 8.1, 2.1), 7.92 (1H, d, J = 2.1).
I-255	109-110°C	1.23 (6H, s), 1.40 (3H, t, J=7.0), 2.62 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.38 (2H, q, J=7.0), 4.51 (2H, s), 6.75 (1H, d, J=8.1), 7.35 (1H, dd, J=8.1, 2.1), 7.90 (1H, d, J=2.1).

表 3 9

物性		
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-256	75-76°C	1.03 (3H, t, J=7.6), 1.22 (6H, s), 1.76 (2H, sext, J= 7.6), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 4.24 (2H, t, J=7.6), 4.51 (2H, s), 6.76 (1H, d, J=8.1), 7.35 (1H, dd, J=8.1, 2.1), 7.92 (1H, d, J=2.1).
I-257	74-76°C	1.24 (6H, s), 1.36 (6H, d, J=6.3), 2.63 (3H, s), 2.70 (2H, s), 4.51 (2H, s), 5.28 (1H, sept, J=6.3), 6.70 (1H, d, J=8.1), 7.32 (1H, dd, J=8.1, 2.1), 7.92 (1H, d, J=2.1).
I-258	102-104°C	1.23 (6H, s), 2.58 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.69 (3H, s), 4.51 (2H, s), 7.20-7.26 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=2.1).
I-259	81-83°C	1.23 (6H, s), 1.38 (3H, t, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.63 (2H, s), 3.18 (2H, q, J=7.3), 4.51 (2H, s), 7.15-7.26 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=2.1).
I-260	78-79°C	1.05 (3H, t, J = 7.4), 1.23 (6H, s), 1.75 (2H, sext, J=7.3), 2.63 (3H, s), 2.65 (2H, s), 3.15 (2H, t, J=7.4), 4.51 (2H, s), 7.15-7.26 (2H, m), 8.20 (1H, d, J=2.1).
I-261	102-103°C	1.23 (6H, s), 1.40 (6H, d, J=6.6), 2.63 (3H, s), 2.66 (2H, s), 4.00 (1H, sept, J=6.6), 4.51 (2H, s), 7.15-7.26 (2H, m), 8.22 (1H, d, J=2.1).
I-262	109-110°C	1.22 (6H, s), 2.61 (3H, s), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.80 (3H, s), 4.48 (2H, s), 6.47 (1H, dd, J=7.9, 2.1), 6.56 (1H, d, J=2.1), 6.95 (1H, d, J=7.9).
I-263	99-100°C	1.22 (6H, s), 2.62 (3H, s), 2.63 (2H, s), 2.64 (6H, s), 3.78 (3H, s), 4.48 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=2.1), 6.64 (1H, dd, J=7.9, 2.1), 6.98 (1H, d, J=7.9).
I-264	114-115°C	0.98 (6H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.16 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.98 (4H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.65 (1H, d, J=7.9), 6.89 (1H, d, J=7.9), 7.13 (1H, t, J=7.9).
I-265	66-67°C	0.98 (6H, t, J=7.0), 1.23 (6H, s), 2.16 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.98 (4H, q, J=7.0), 4.52 (2H, s), 6.63 (1H, dd, J=7.9, 2.1), 6.70 (1H, d, J=2.1), 7.16 (1H, d, J = 7.9).
I-266	88-90°C	1.04 (6H, t, J=7.0), 1.24 (6H, s), 2.63 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.17 (4H, q, J=7.0), 3.86 (3H, s), 4.51 (2H, s), 6.67 (1H, s), 6.70 (1H, d, J=7.9), 6.85 (1H, d, J=7.9).

表 4 0

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-267	138- 140°C	0.82-0.92 (9H, m), 1.18 (3H, d, J=6.9), 1.51-1.65 (6H, m), 2.62 (2H, s), 2.65 (3H, s), 2.87 (1H, sept, J=6.9), 4.33 (1H, d, J=13.5), 4.59 (1H, d, J=13.5), 6.89-6.92 (1H, m), 7.13-7.28 (3H, m)
I-268	161- 163°C	0.89-0.95 (6H, m), 1.21 (6H, d, J=6.9), 1.25-1.54 (8H, m), 2.62 (2H, s), 2.65 (3H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 4.47 (2H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.14-7.18 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
I-269		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.65-1.88 (8H, m), 2.64 (3H, s), 2.75 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.57 (2H, s), 6.90-6.94 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
I-270		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.37-1.54 (8H, m), 1.76-1.80 (2H, m), 2.65 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.54 (2H, s), 6.89 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)

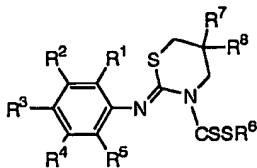
表 4 1

化 合 物 番 号	物 性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
I-271		1.04 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.29 (6H, d, J=6.9), 2.69(2H, s), 3.40 (1H, sept, J=6.9), 3.43 (3H, s), 3.51 (2H, s), 7.18-7.29 (2H, m), 7.36-7.45 (2H, m)
I-272		0.96 (3H, s), 1.05 (3H, s), 1.25 (3H, d, J=6.9), 1.26 (3H, d, J=6.9), 2.61 (1H, d, J=12), 2.70 (1H, d, J=12), 3.39 (1H, sept, J=6.9), 3.45-3.58 (2H, m), 7.02-7.07 (2H, m), 7.11-7.18 (1H, m), 7.38-7.45 (2H, m), 7.61-7.70 (2H, m)
I-273		0.84 (3H, s), 1.00 (3H, s), 1.25 (3H, d, J=6.9), 1.29 (3H, J=6.9), 2.43 (3H, s), 2.53 (1H, d, J=12), 2.64 (1H, d, J=12), 3.29 (1H, d, J=16), 3.42 (1H, d, J=16), 3.47 (1H, sept, J=6.9), 7.09-7.19 (2H, m), 7.24-7.29 (2H, m), 7.38-7.45 (2H, m), 7.81-7.86 (2H, m)
I-274		0.99 (6H, s), 1.19 (6H, d, J=6.9), 2.40 (3H, s), 2.67 (2H, s), 2.87 (1H, sept, J=6.9), 3.43 (2H, s), 7.11-7.29 (6H, m), 7.68 (2H, d, J=8.1)
I-275		1.07 (6H, s), 1.26 (6H, d, J=6.9), 1.38 (3H, t, J=7.2), 2.71 (2H, s), 2.93 (1H, sept, J=6.9), 3.51 (2H, s), 3.60 (2H, q, J=7.2), 7.20-7.30 (4H, m)
I-276		1.19 (6H, s), 1.23 (6H, d, J=6.9), 2.77 (2H, s), 2.87 (1H, sept, J=6.9), 3.58 (2H, s), 6.65-6.69 (2H, m), 6.91 (1H, d, J=7.5), 7.20 (1H, t, J=7.5), 7.51 (2H, d, J=9.3), 8.22 (2H, d, J=9.3)
I-277		0.99 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 2.67 (2H, s), 2.88 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (2H, s), 3.85 (3H, s), 6.86-6.90 (2H, m), 7.11-7.26 (4H, m), 7.72-7.76 (2H, m)

表 4 2

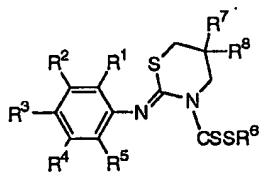
化 合 物 番 号	物 性	
No	融 点	NMR (CDCl ₃)
I-278		1.03 (6H, s), 1.20 (6H, d, J=6.9), 2.70 (2H, s), 2.88 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (2H, s), 7.08-7.31 (4H, m), 7.60 (1H, t, J=8.4), 8.04 (1H, d, J=8.4), 8.39 (d, J=8.4), 8.74 (1H, s)
I-279		1.01 (6H, s), 1.19 (6H, d, J=6.9), 2.69 (2H, s), 2.88 (1H, sept, J=6.9), 3.42 (2H, s), 7.09-7.32 (4H, m), 7.68 (2H, d, J=8.4), 7.92 (2H, d, J=8.4),
I-280		1.19 (3H, s), 1.21 (3H, s), 1.23-1.30 (6H, m), 2.62 (1H, d, J=12), 2.82 (1H, sept, J=6.9), 3.02 (1H, d, J=12), 3.46-3.70 (2H, m), 6.53-6.60 (2H, m), 6.86 (1H, d, J=7.8), 7.13 (1H, t, J=7.8), 7.28-7.40 (2H, m), 7.61-7.66 (1H, m), 7.90 (1H, dd, J=7.5, 1.2)

表 4 3



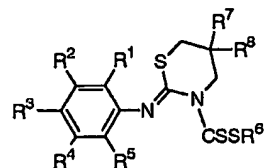
No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-1	Pr ⁱ	H	H	H	H	Allyl	Me	Me
II-2	Pr ⁱ	H	H	H	H	Propargyl	Me	Me
II-3	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CN	Me	Me
II-4	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ OMe	Me	Me
II-5	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH=CHMe	Me	Me
II-6	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH=CMe ₂	Me	Me
II-7	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me
II-8	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ COMe	Me	Me
II-9	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ H	Me	Me
II-10	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	Me	Me
II-11	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-12	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Pr	Me	Me
II-13	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Pr ⁱ	Me	Me
II-14	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ⁱ	Me	Me
II-15	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ CH=CH ₂	Me	Me
II-16	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Me	Me
II-17	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Me	Me
II-18	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH(Me)CO ₂ Me	Me	Me
II-19	Pr ⁱ	H	H	H	H	C(Me) ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-20	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CONH ₂	Me	Me
II-21	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CONMe ₂	Me	Me
II-22	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CON(Me)OMe	Me	Me
II-23	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CF ₃	Me	Me
II-24	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OCOMe	Me	Me
II-25	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OPh	Me	Me

表 4 4



No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-26	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH=CH ₂	Me	Me
II-27	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-28	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-29	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-30	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-31	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-32	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-33	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-34	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-35	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-36	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-37	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-38	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-39	Pr ⁱ	H	H	H	H	Allyl	Et	Et
II-40	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Et	Et
II-41	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Pr ⁱ	Et	Et
II-42	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et
II-43	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CO ₂ Et	Et	Et

表 4 5




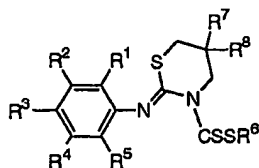
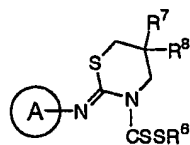
No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-44	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH=CHMe	Et	Et
II-45	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH=CMe ₂	Et	Et
II-46	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et
II-47	Bu ^s	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-48	Bu ^s	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-49	Bu ^s	H	H	H	H	Allyl	Et	Et
II-50	Bu ^s	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OCOMe	Et	Et
II-51	Bu ^s	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ -N ₂ 	Et	Et
II-52	H	H	Et	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-53	H	Pr ⁱ	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-54	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-55	H	NMe ₂	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-56	H	NEt ₂	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Me
II-57	H	H	Et	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-58	H	Pr ⁱ	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-59	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-60	H	NMe ₂	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-61	H	NEt ₂	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-62	H	NEt ₂	H	H	H	Allyl	Me	Me
II-63	Me	NEt ₂	H	H	H	Allyl	Me	Me
II-64	Me	NMe ₂	H	H	H	Allyl	Me	Me
II-65	NMe ₂	H	H	H	H	Allyl	Et	Et
II-66	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et
II-67	OMe	H	H	H	H	Allyl	Et	Et
II-68	OMe	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et
II-69	H	H	Et	H	H	Allyl	Et	Et
II-70	H	H	Et	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et

表 4 6



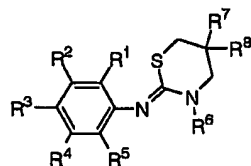
No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-71	H	H	OCF ₃	H	H	Allyl	Et	Et
II-72	H	H	OCF ₃	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et
II-73	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ OMe	Et	Et
II-74	Pr ⁱ	H	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-75	NMe ₂	H	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-76	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	-(CH ₂) ₄ -	
II-77	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₄ -	
II-78	Pr ⁱ	H	H	H	H		-(CH ₂) ₄ -	
II-79	OMe	H	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-80	OMe	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	-(CH ₂) ₄ -	
II-81	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ OMe	-(CH ₂) ₄ -	
II-82	H	H	Et	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-83	H	H	OCF ₃	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-84	NMe ₂	H	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-85	NMe ₂	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	-(CH ₂) ₅ -	
II-86	OMe	H	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-87	OMe	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Bu ^t	-(CH ₂) ₅ -	
II-88	H	H	Et	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-89	Pr ⁱ	H	H	H	H		-(CH ₂) ₅ -	
II-90	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ OH	-(CH ₂) ₅ -	
II-91	H	H	OCF ₃	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-92	Pr ⁱ	H	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
II-93	Pr ⁱ	H	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
II-94	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ H	Et	Et

表 4 7



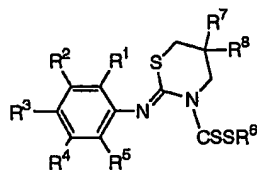
	A	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-95		Allyl	Me	Me
II-96		CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Me	Me
II-97		CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₂ OMe	Me	Me
II-98		Allyl	Et	Et
II-99		CH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et
II-100		Allyl	Et	Et
II-101		Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-102		CH ₂ CO ₂ Bu ^t	-(CH ₂) ₄ -	
II-103		Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-104		Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-105		Allyl	-(CH ₂) ₅ -	

表 4 8



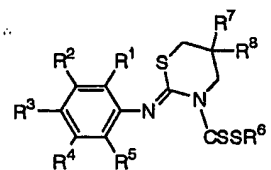
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-106	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-107	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-108	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-109	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-110	H	H	Pr	H	H		Me	Me
II-111	Pr ⁱ	H	H	H	H		Et	Et
II-112	Pr ⁱ	H	H	H	H		Me	Me
II-113	Pr ⁱ	H	H	H	H	CSSMe	-(CH ₂) ₂ N(CH ₂ Ph)(CH ₂) ₂ -	

表 4 9



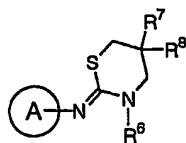
	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-114	H	SMe	H	H	H	Allyl	Et	Et
II-115	H	SMe	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-116	H	SMe	H	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-117	H	H	SMe	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-118	H	H	SMe	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-119	OMe	H	Et	H	H	Allyl	Me	Me
II-120	OMe	H	Pr ⁱ	H	H	Allyl	Me	Me
II-121	Pr ⁱ	H	OMe	H	H	Allyl	Me	Me
II-122	Pr ⁱ	H	OEt	H	H	Allyl	Me	Me
II-123	H	OEt	OEt	H	H	Allyl	Me	Me
II-124	H	OPr	OPr	H	H	Allyl	Me	Me
II-125	H	OMs	OEt	H	H	Allyl	Me	Me
II-126	H	H	(CH ₂) ₂ OEt	H	H	Allyl	Me	Me
II-127	H	OMe	OEt	H	H	Allyl	Et	Et
II-128	H	OEt	OEt	H	H	Allyl	Et	Et
II-129	H	OEt	OPr	H	H	Allyl	Et	Et
II-130	H	OMs	OPr	H	H	Allyl	Et	Et
II-131	H	OPr	OPr	H	H	Allyl	Et	Et
II-132	H	OPr ⁱ	OPr	H	H	Allyl	Et	Et
II-133	H	H	(CH ₂) ₂ NMe ₂	H	H	Allyl	Me	Me
II-134	Pr ⁱ	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ B u ⁱ	-(CH ₂) ₅ -	
II-135	Pr ⁱ	H	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ N(Me)(CH ₂) ₂ -	
II-136	Pr ⁱ	H	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ N(Et)(CH ₂) ₂ -	
II-137	F	H	F	H	H	Allyl	Me	Me
II-138	H	Cl	Cl	H	H	Allyl	Me	Me
II-139	Me	H	Cl	H	H	Allyl	Me	Me
II-140	Cl	H	Me	H	H	Allyl	Me	Me
II-141	H	H	(CH ₂) ₂ OMe	H	H	Allyl	Me	Me
II-142	H	H	Pr ⁱ	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₄ -	
II-143	H	H	Pr ⁱ	H	H	CH ₂ CO ₂ B u ⁱ	-(CH ₂) ₄ -	

表 5 0



	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-144	H	H	Pr ⁱ	H	H	Allyl	Et	Et
II-145	H	H	Pr ⁱ	H	H	CH ₂ CO ₂ B _{u^t}	Et	Et
II-146	H	H	Pr ⁱ	H	H	Allyl	-(CH ₂) ₅ -	
II-147	OMe	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ B _{u^t}	Pr	Pr
II-148	OMe	H	H	H	H	CH ₂ CO ₂ B _{u^t}	Pr ⁱ	Pr ⁱ
II-149	OMe	H	H	H	H	Allyl	Pr	Pr
II-150	Bu ^s	H	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ N(Me)(CH ₂) ₂ -	

表 5 1



	A	R ⁶	R ⁷	R ⁸
II-151		CSSCH ₂ CO ₂ Bu ^t	-(CH ₂) ₅ -	
II-152		CSSCH ₂ CO ₂ Bu ^t	Et	Et
II-153		COSMe	-(CH ₂) ₂ N(Me)(CH ₂) ₂ -	
II-154		COSMe	-(CH ₂) ₂ N(Me)(CH ₂) ₂ -	

表 5 2

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-1		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.66 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.93-3.97 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.15-5.19 (1H, m), 5.28-5.39 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.89-6.94 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-2	93.5-94.5	1.21 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.20 (1H, t, J=2.6), 2.69 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.99 (2H, d, J=2.6), 4.49 (2H, s), 6.90-6.94 (1H, m), 7.14-7.22 (2H, m), 7.32-7.35 (1H, m)
II-3		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.25 (6H, s), 2.74 (2H, s), 3.02 (1H, sept, J=6.9), 4.00 (2H, s), 4.50 (2H, s), 6.87-6.90 (1H, m), 7.15-7.22 (2H, m), 7.32-7.36 (1H, m)
II-4	73-74	1.21 (6H, d, J=6.9), 1.24 (6H, s), 2.67 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.44 (3H, s), 4.48 (2H, s), 5.45 (2H, s), 6.92-6.96 (1H, m), 7.16-7.20 (2H, m), 7.32-7.35 (1H, m)
II-5		1.19 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.71 (3H, d, J=6.6), 2.64 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.88 (2H, d, J=6.9), 4.49 (2H, s), 5.56-5.62 (1H, m), 5.69-5.78 (1H, m), 6.89-6.94 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-6		1.19 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 1.72 (3H, d, J=6.9), 2.65 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.89 (2H, d, J=6.9), 4.49 (2H, s), 5.28-5.35 (1H, m), 6.87-6.92 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-7		1.19 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.47 (2H, q, J=7.4), 2.64 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.34 (2H, t, J=7.4), 4.48 (2H, s), 5.01-5.14 (2H, m), 5.74-5.98 (1H, m), 6.82-6.89 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-8	92-96	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.35 (3H, s), 2.70 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 4.12 (2H, s), 4.46 (2H, s), 6.92-6.97 (1H, m), 7.11-7.22 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
II-9		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.24 (6H, s), 2.74 (2H, s), 3.05 (1H, sept, J=6.9), 4.17 (2H, s), 4.39 (2H, s), 6.93-6.97 (1H, m), 7.18-7.24 (2H, m), 7.33-7.38 (1H, m)
II-10	82-83	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.70 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.75 (3H, s), 4.07 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.92-6.95 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.31-7.35 (1H, m)

表 5 3

化合物番 号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-11	95.5- 96.5	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.3), 2.70 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.06 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=7.3), 4.48 (2H, s), 6.92-6.96 (1H, m), 7.15-7.19 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-12	83-86	0.96 (3H, t, J=7.3), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.68 (2H, sext, J=7.3), 2.70 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.07 (2H, s), 4.11 (2H, t, J=7.3), 4.48 (2H, s), 6.92-6.95 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-13	95-96	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.27 (6H, d, J=6.3), 2.70 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.02 (2H, s), 4.47 (2H, s), 5.06 (1H, sept, J=6.3), 6.92-6.97 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-14		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.47 (9H, s), 2.69 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.97 (2H, s), 4.47 (2H, s), 6.92-6.96 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-15		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.70 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 4.13 (2H, s), 4.48 (2H, s), 4.62 (1H, dd, J=6.3, 1.7), 4.95 (1H, dd, J=13.9, 1.7), 6.92-6.95 (1H, m), 7.13-7.35 (4H, m)
II-16		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.69 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 4.10 (2H, s), 4.47 (2H, s), 4.63-4.66 (2H, m), 5.23-5.39 (2H, m), 5.86-5.98 (1H, m), 6.92-6.95 (1H, m), 7.15-7.21 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-17		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.70 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.40 (3H, s), 3.61-3.65 (2H, m), 4.11 (2H, d, J=2.3), 4.29-4.37 (2H, m), 4.47 (2H, s), 6.92-6.95 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-18		1.19-1.23 (12H, m), 1.58 (3H, d, J=7.3), 2.62 (1H, d, J=13.2), 2.74 (1H, d, J=13.2), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.74 (3H, s), 4.18 (1H, d, J=13.5), 4.66 (1H, q, J=7.3), 4.72 (1H, d, J=13.5), 6.91-6.94 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.31-7.35 (1H, m)
II-19		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.21 (6H, s), 1.28 (3H, t, J=7.3), 1.71 (6H, s), 2.66 (2H, s), 3.14 (1H, sept, J=6.9), 4.18 (2H, q, J=7.3), 4.40 (2H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.31-7.35 (1H, m)
II-20	117- 119	1.21 (6H, d, J=6.9), 1.24 (6H, s), 2.69 (2H, s), 3.05 (1H, sept, J=6.9), 4.03 (2H, s), 4.48 (2H, s), 5.35 (1H, brs), 6.50 (1H, brs), 6.89-6.92 (1H, m), 7.14-7.22 (2H, m), 7.32-7.35 (1H, m)

表 5 4

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-21		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.69 (2H, s), 2.97 (3H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.15 (3H, s), 4.20 (2H, s), 4.47 (2H, s), 6.94-6.97 (1H, m), 7.12-7.20 (2H, m), 7.30-7.33 (1H, m)
II-22		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.71 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.23 (3H, s), 3.82 (3H, s), 4.33 (2H, s), 4.47 (2H, s), 6.95-7.00 (1H, m), 7.12-7.21 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m)
II-23		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.68 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.22 (2H, q, J=9.9), 4.50 (2H, s), 6.89-6.95 (1H, m), 7.14-7.23 (2H, m), 7.31-7.36 (1H, m)
II-24		1.18 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.07 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.57 (2H, t, J=6.6), 4.35 (2H, t, J=6.6), 4.49 (2H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.13-7.22 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
II-25		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.65 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.71 (2H, t, J=6.6), 4.29 (2H, t, J=6.6), 4.49 (2H, s), 6.89-6.97 (4H, m), 7.15-7.21 (2H, m), 7.25-7.34 (3H, m)
II-26		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.66 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.60 (2H, t, J=6.6), 3.99-4.05 (3H, m), 4.24 (1H, dd, 14.2, 1.9), 4.49 (2H, s), 6.47 (1H, dd, 14.2, 6.9), 6.89-6.94 (1H, m), 7.15-7.21 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-27		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.64 (2H, s, J=4.6), 3.84-4.03 (4H, m), 4.49 (2H, s), 5.21 (1H, t, J=4.6), 6.91-6.96 (1H, m), 7.12-7.21 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m)
II-28	124-126	1.17 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.38 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.06 (1H, sept, J=6.9), 4.50 (2H, s), 4.55 (2H, s), 6.05 (1H, s), 6.86-6.90 (1H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.30-7.33 (1H, m)
II-29		0.94 (6H, d, J=6.6), 1.17 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 1.93-2.08 (1H, m), 2.58 (2H, d, J=6.6), 2.66 (2H, s), 3.07 (1H, sept, J=6.9), 4.50 (2H, s), 4.55 (2H, s), 6.05 (1H, s), 6.85-6.91 (1H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.28-7.33 (1H, m)
II-30	129-130	1.17 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 1.31 (9H, s), 2.67 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 4.51 (2H, s), 4.59 (2H, s), 6.00 (1H, s), 6.87-6.91 (1H, m), 7.14-7.19 (2H, m), 7.30-7.33 (1H, m)

表 5 5

化合物番号	物性	
	No	融点
NMR (CDCl ₃)		
II-31		1.18 (6H, d, J=6.9), 1.24 (6H, s), 2.68 (2H, s), 3.07 (1H, sept, J=6.9), 4.52 (2H, s), 4.64 (2H, s), 6.61 (1H, s), 6.88-6.91 (1H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.29-7.33 (1H, m), 7.41-7.48 (3H, m), 7.71-7.76 (2H, m)
II-32		1.18 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.26 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.06 (1H, sept, J=6.9), 4.48 (2H, s), 4.58 (2H, s), 6.09 (1H, s), 6.87-6.92 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.28-7.34 (1H, m)
II-33		1.18 (6H, d, J=6.9), 1.21 (6H, s), 1.25 (6H, d, J=6.9), 2.66 (2H, s), 3.02 (1H, sept, J=6.9), 3.04 (1H, sept, J=6.9), 4.49 (2H, s), 4.59 (2H, s), 6.12 (1H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-34		0.94 (6H, d, J=6.6), 1.18 (6H, d, J=6.9), 1.21 (6H, s), 1.88-2.05 (1H, m), 2.49 (2H, d, J=6.6), 2.65 (2H, s), 3.07 (1H, sept, J=6.9), 4.49 (2H, s), 4.59 (2H, s), 6.09 (1H, s), 6.87-6.91 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-35	124-125	1.18 (6H, d, J=6.9), 1.21 (6H, s), 1.30 (9H, s), 2.65 (2H, s), 3.07 (1H, sept, J=6.9), 4.49 (2H, s), 4.59 (2H, s), 6.15 (1H, s), 6.88-6.93 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-36		1.17 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.26 (9H, s), 2.67 (2H, s), 3.07 (1H, sept, J=6.9), 4.49 (2H, s), 4.59 (2H, s), 6.61 (1H, s), 6.88-6.92 (1H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.29-7.32 (1H, m)
II-37		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 2.52-2.56 (4H, m), 2.65 (2H, s), 2.68-2.73 (2H, m), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.41-3.52 (2H, m), 3.70-3.73 (4H, m), 4.48 (2H, s), 6.87-6.92 (1H, m), 7.15-7.19 (2H, m), 7.31-7.35 (1H, m)
II-38	123.5-124.5	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.23 (6H, s), 1.38 (6H, s), 2.67 (2H, s), 2.80 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 4.32 (2H, s), 4.49 (2H, s), 6.87-6.91 (1H, m), 7.16-7.21 (2H, m), 7.31-7.35 (1H, m)
II-39		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.47-1.62 (4H, m), 2.61 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.93-3.97 (2H, m), 4.43 (2H, s), 5.15-5.19 (1H, m), 5.28-5.39 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.89-6.94 (1H, m), 7.16-7.21 (2H, m), 7.30-7.36 (1H, m)
II-40		0.87 (6H, t, J=7.4), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.28 (3H, t, J=7.3), 1.42-1.60 (4H, m), 2.64 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 4.06 (2H, s), 4.21 (2H, q, J=7.3), 4.43 (2H, s), 6.91-6.96 (1H, m), 7.15-7.19 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)

表 5 6

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-41		0.87 (6H, t, J=7.4), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.27 (6H, d, J=7.0), 1.48-1.63 (4H, m), 2.65 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 4.02 (2H, s), 4.43 (2H, s), 5.01 (1H, sept, J=7.0), 6.91-6.96 (1H, m), 7.15-7.19 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-42		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.46 (9H, s), 1.42-1.60 (4H, m), 2.64 (2H, s), 3.11 (1H, sept, J=6.9), 3.90 (2H, s), 4.42 (2H, s), 6.89-6.96 (1H, m), 7.18-7.23 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-43		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.26 (3H, t, J=7.0), 1.42-1.60 (4H, m), 2.60 (2H, s), 2.79 (2H, t, J=7.2), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.54 (2H, t, J=7.2), 4.16 (2H, q, J=7.0), 4.43 (2H, s), 6.89-6.94 (1H, m), 7.15-7.19 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-44		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.19 (6H, d, J=6.9), 1.50-1.70 (4H, m), 1.71 (3H, d, J=6.9), 2.61 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.88 (2H, d, J=6.9), 4.43 (2H, s), 5.56-5.62 (1H, m), 5.69-5.78 (1H, m), 6.89-6.94 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-45		0.88 (6H, t, J=7.2), 1.19 (6H, d, J=6.9), 1.48-1.65 (4H, m), 1.72 (6H, d, J=6.9), 2.61 (2H, s), 3.15 (1H, sept, J=6.9), 3.89 (2H, d, J=6.9), 4.44 (2H, s), 5.28-5.35 (1H, m), 6.87-6.92 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-46		0.88 (6H, t, J=7.1), 1.19 (6H, d, J=6.9), 1.48-1.65 (4H, m), 2.47 (2H, q, J=7.4), 2.60 (2H, s), 3.12 (1H, sept, J=6.9), 3.34 (2H, t, J=7.4), 4.44 (2H, s), 5.01-5.14 (2H, m), 5.74-5.98 (1H, m), 6.82-6.89 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-47		0.85 (3H, t, J=7.4), 1.18 (3H, d, J=7.4), 1.23 (6H, s), 1.26 (3H, t, J=7.0), 1.42-1.60 (4H, m), 2.68 (2H, s), 3.11 (1H, sext, J=7.0), 4.06 (2H, s), 4.15 (2H, q, J=7.0), 4.38 (1H, d, J=13.5), 4.57 (1H, d, J=13.5), 6.83-6.90 (1H, m), 7.11-7.19 (2H, m), 7.28-7.31 (1H, m)
II-48		0.85 (3H, t, J=7.4), 1.18 (3H, d, J=7.4), 1.23 (6H, s), 1.47 (9H, s), 1.42-1.60 (4H, m), 2.68 (2H, s), 3.00 (1H, sext, J=7.0), 4.01 (2H, s), 4.38 (1H, d, J=13.5), 4.57 (1H, d, J=13.5), 6.89-6.95 (1H, m), 7.11-7.19 (2H, m), 7.28-7.31 (1H, m)
II-49		0.82-0.91 (9H, m), 1.17 (3H, d, J=6.9), 2.61 (2H, s), 2.87 (1H, sext, J=6.9), 3.65 (2H, d, J=6.9), 4.30 (1H, d, J=13.5), 4.57 (1H, d, J=13.5), 5.15-5.35 (2H, m), 5.86-5.99 (1H, m), 6.88-6.92 (1H, m), 7.11-7.28 (3H, m)
II-50		0.83-0.92 (9H, m), 1.18 (3H, d, J=6.9), 1.47-1.69 (6H, m), 2.06 (3H, s), 2.62 (2H, s), 2.87 (1H, sext, J=6.9), 3.58 (2H, t, J=6.6), 4.31 (1H, d, J=13.9), 4.35 (2H, t, J=6.6), 4.55 (1H, d, J=13.9), 6.88-6.91 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.25-7.29 (1H, m)

表 5 7

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-51		0.83-0.92 (9H, m), 1.18 (3H, d, J=6.9), 2.53-2.56 (4H, m), 2.60 (2H, s), 2.71 (2H, t, J=7.3), 2.90 (1H, sept, J=6.9), 3.45 (2H, t, J=7.3), 3.69-3.73 (6H, m), 4.32 (1H, d, J=13.9), 4.55 (1H, d, J=13.9), 6.89-6.91 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.25-7.29 (1H, m)
II-52		1.22 (6H, s), 1.24 (3H, t, J=7.3), 1.33 (3H, t, J=7.2), 2.64 (2H, q, J=7.3), 2.66 (2H, s), 4.06 (2H, s), 4.20 (2H, q, J=7.2), 4.48 (2H, s), 6.97 (2H, d, J=8.3), 7.20 (2H, d, J=8.3)
II-53		1.22 (6H, s), 1.26 (6H, d, J=6.9), 1.29 (3H, t, J=7.2), 2.70 (2H, s), 2.94 (1H, sept, J=6.9), 4.06 (2H, s), 4.12 (2H, q, J=7.2), 4.49 (2H, s), 6.85-6.90 (2H, m), 7.04-7.10 (1H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-54		1.23 (6H, s), 1.29 (3H, t, J=7.3), 2.68 (2H, s), 2.72 (6H, s), 4.07 (2H, s), 4.22 (2H, q, J=7.3), 4.49 (2H, s), 6.98-7.10 (4H, m)
II-55		1.27 (6H, s), 1.33 (3H, t, J=7.3), 2.73 (2H, s), 3.01 (6H, s), 4.10 (2H, s), 4.25 (2H, q, J=7.3), 4.54 (2H, s), 6.41 (1H, d, J=2.3), 6.48 (1H, d, J=7.6), 6.60 (1H, dd, J=7.6, 2.3), 7.20 (1H, d, J=7.6)
II-56		1.16 (6H, t, J=7.3), 1.21 (6H, s), 1.28 (3H, t, J=7.3), 2.68 (2H, s), 3.35 (4H, q, J=7.3), 4.05 (2H, s), 4.19 (2H, q, J=7.3), 4.48 (2H, s), 6.29 (1H, d, J=2.3), 6.32 (1H, d, J=8.6), 6.50 (1H, dd, J=8.6, 2.3), 7.20 (1H, d, J=8.6)
II-57		1.21 (6H, s), 1.22 (3H, t, J=7.6), 1.46 (9H, s), 2.65 (2H, q, J=7.6), 2.69 (2H, s), 3.96 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.97 (2H, d, J=8.3), 7.20 (2H, d, J=8.3)
II-58		1.21 (6H, s), 1.25 (6H, d, J=6.9), 1.56 (9H, s), 2.69 (2H, s), 2.90 (1H, sept, J=6.9), 3.97 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.85-6.90 (2H, m), 7.04-7.10 (1H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-59		1.21 (6H, s), 1.56 (9H, s), 2.67 (2H, s), 2.69 (6H, s), 3.96 (2H, s), 4.47 (2H, s), 6.98-7.10 (4H, m)
II-60		1.21 (6H, s), 1.47 (9H, s), 2.68 (2H, s), 2.96 (6H, s), 3.96 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.36 (1H, d, J=7.6), 6.37 (1H, d, J=2.3), 6.55 (1H, dd, J=7.6, 2.3), 7.20 (1H, d, J=7.6)

表 5.8

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-61		1.16 (6H, t, J=7.3), 1.21 (6H, s), 1.57 (9H, s), 2.68 (2H, s), 3.35 (4H, q, J=7.3), 3.93 (2H, s), 4.48 (2H, s), 6.29 (1H, d, J=2.3), 6.32 (1H, d, J=8.6), 6.50 (1H, dd, J=8.6, 2.3), 7.20 (1H, d, J=8.6)
II-62		1.15 (6H, t, J=7.2), 1.22 (6H, s), 2.65 (2H, s), 3.31 (4H, q, J=7.3), 3.93-3.97 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.15-5.19 (1H, m), 5.28-5.39 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.28 (1H, d, J=2.2), 6.32 (1H, d, J=8.6), 6.50 (1H, dd, J=8.6, 2.2), 7.20 (1H, d, J=8.6)
II-63		0.97 (6H, t, J=7.2), 1.22 (6H, s), 2.15 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.97 (4H, q, J=7.3), 3.93-3.97 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.15-5.19 (1H, m), 5.28-5.39 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.64 (1H, d, J=7.9), 6.90 (1H, d, J=7.9), 7.15 (1H, d, J=7.9)
II-64		1.22 (6H, s), 2.16 (3H, s), 2.64 (2H, s), 2.68 (6H, s), 3.93-3.97 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.15-5.19 (1H, m), 5.28-5.39 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.63 (1H, d, J=7.9), 6.85 (1H, d, J=7.9), 7.12 (1H, d, J=7.9)
II-65		0.88 (6H, t, J=7.3), 1.43-1.65 (4H, m), 2.60 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.94 (2H, d, J=6.9), 4.43 (2H, s), 5.16 (2H, d, J=10.2), 5.31 (1H, dd, J=16.8, 1.3), 5.86-6.01 (1H, m), 6.93-7.03 (3H, m), 7.08-7.14 (1H, m)
II-66		0.87 (6H, t, J=7.3), 1.47 (9H, s), 1.48-1.63 (4H, m), 2.62 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.96 (2H, s), 4.43 (2H, s), 6.92-7.14 (4H, m)
II-67		0.88 (6H, t, J=7.6), 1.47-1.65 (4H, m), 2.60 (2H, s), 3.82 (3H, s), 3.92-3.95 (2H, m), 4.48 (2H, s), 5.14-5.19 (1H, m), 5.32 (1H dd, J=16.8, 1.3), 5.87-6.00 (1H, m), 6.93-7.00 (3H, m), 7.10-7.17 (1H, m)
II-68		0.87 (6H, t, J=7.6), 1.47 (9H, s), 1.51-1.60 (4H, m), 2.63 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.96 (2H, s), 4.47 (2H, s), 6.93-7.03 (3H, m), 7.10-7.14 (1H, m)
II-69		0.86 (6H, t, J=7.6), 1.24 (3H, t, J=7.6), 1.41-1.65 (4H, m), 2.61-2.71 (4H, m), 3.94 (2H, d, J=7.3), 4.45 (2H, s), 5.16 (1H, d, J=9.9), 5.28-5.34 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.94-6.98 (1H, m), 7.18-7.21 (2H, m)
II-70		0.88 (6H, t, J=7.6), 1.47 (9H, s), 1.49-1.58 (4H, m), 2.61-2.70 (4H, m), 3.97 (2H, s), 4.45 (2H, s), 6.96-6.99 (2H, m), 7.18-7.21 (2H, m)

表 5 9

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-71		0.89 (6H, t, J=7.6), 1.47-1.65 (4H, m), 2.64 (2H, s), 3.94 (2H, d, J=7.3), 4.45 (2H, s), 5.18 (1H, d, J=9.9), 5.32 (1H, dd, J=17.2, 1.3), 5.86-6.01 (1H, m), 7.01-7.06 (2H, m), 7.20-7.23 (2H, m)
II-72		0.88 (6H, t, J=7.3), 1.47 (9H, s), 1.48-1.66 (4H, m), 2.67 (2H, s), 3.97 (2H, s), 4.44 (2H, s), 7.03-7.08 (2H, m), 7.20-7.26 (2H, m)
II-73	103.5- 104.5	0.88 (6H, t, J=7.3), 1.50-1.63 (4H, m), 2.62 (2H, s), 2.72 (6H, s), 3.43 (3H, s), 4.43 (2H, s), 5.45 (2H, s), 6.95-7.18 (4H, m)
II-74		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.60-1.87 (8H, m), 2.74 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.93-3.96 (2H, m), 5.15 (1H, dd, J=9.9, 1.3), 5.31 (1H, dd, J=17.1, 1.3), 5.86-6.01 (1H, m), 6.90-9.94 (1H, m), 7.12-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-75		1.62-1.86 (8H, m), 2.72 (6H, s), 3.92-3.95 (2H, m), 4.55 (2H, s), 5.15 (1H, d, J=10.0), 5.26-5.33 (1H, m), 5.86-5.98 (1H, m), 6.93-7.01 (3H, m), 7.09-7.16 (1H, m)
II-76		1.47 (9H, s), 1.64-1.76 (8H, m), 2.71 (6H, s), 2.76 (2H, s), 3.95 (2H, s), 4.54 (2H, s), 6.92-7.05 (3H, m), 7.09-7.15 (1H, m)
II-77	85.5- 87.5	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.60-1.84 (8H, m), 2.79 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.40 (3H, s), 3.61-3.64 (2H, m), 4.09 (2H, s), 4.29-4.32 (2H, m), 4.52 (2H, s), 6.92-6.95 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.31-7.34 (1H, m)
II-78		1.19 (6H, d, J=6.9), 1.60-1.87 (8H, m), 2.23 (3H, s), 2.76 (2H, s), 3.06 (1H, sept, J=6.9), 4.53 (2H, s), 4.57 (2H, s), 6.09 (1H, s), 6.87-6.92 (1H, m), 7.13-7.20 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-79		1.64-1.84 (8H, m), 2.75 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.93 (2H, d, J=6.9), 4.56 (2H, s), 5.16 (1H, d, J=9.9), 5.31 (1H, dd, J=17.1, 1.7), 5.87-5.99 (1H, m), 6.92-7.01 (3H, m), 7.11-7.18 (1H, m)
II-80		1.47 (9H, s), 1.64-1.83 (8H, m), 2.78 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.96 (2H, s), 4.55 (2H, s), 6.92-7.04 (3H, m), 7.11-7.18 (1H, m)

表 6 0

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-81		1.57-1.86 (8H, m), 2.73 (6H, s), 2.74 (2H, s), 3.42 (3H, s), 4.55 (2H, s), 5.44 (2H, s), 6.94-7.04 (3H, m), 7.11-7.17 (1H, m)
II-82		1.24 (3H, t, J=7.6), 1.65-1.87 (8H, m), 2.65 (2H, m), 3.93-3.95 (2H, m), 4.54 (2H, m), 5.16 (1H, d, J=9.9), 5.27-5.35 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 6.93-6.98 (2H, m), 7.19-7.22 (1H, m)
II-83		1.55-1.84 (8H, m), 2.77 (2H, s), 3.92-3.95 (2H, m), 4.55 (2H, s), 5.18 (1H, d, J=9.9), 5.28-5.35 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 7.01-7.06 (2H, m), 7.22 (2H, d, J=8.9)
II-84		1.37-1.60 (8H, m), 1.73-1.86 (2H, m), 2.65 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.94 (2H, d, J=7.3), 4.52 (2H, s), 5.15 (1H, d, J=9.9), 5.30 (1H, dd, J=17.2, 1.3), 5.86-6.01 (1H, m), 6.93-7.15 (4H, m)
II-85		1.36-1.62 (8H, m), 1.47 (9H, s), 1.69-1.82 (2H, m), 2.67 (2H, s), 2.70 (6H, s), 3.79 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.93-7.14 (4H, m)
II-86	108.5-109.5	1.33-1.62 (8H, m), 1.75-1.82 (2H, m), 2.65 (2H, s), 3.82 (3H, s), 3.94 (2H, d, J=6.9), 4.56 (2H, s), 5.15 (1H, d, J=10.2), 5.31 (1H, dd, J=17.2, 1.6), 5.88-6.02 (1H, m), 6.93-7.02 (3H, m), 7.10-7.17 (1H, m)
II-87		1.23-1.78 (10H, m), 1.46 (9H, s), 2.67 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.97 (2H, s), 4.55 (2H, s), 6.89-7.05 (3H, m), 7.10-7.17 (12H, m)
II-88	98-100	1.24 (3H, t, J=7.6), 1.36-1.54 (8H, m), 1.76-1.81 (2H, m), 2.61-2.69 (4H, m), 3.94 (2H, d, J=6.9), 4.53 (2H, s), 5.16 (1H, d, J=9.9), 5.27-5.34 (1H, m), 5.86-5.98 (1H, m), 6.95-6.98 (2H, m), 7.18-7.21 (2H, m)
II-89		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.37-1.90 (16H, m), 2.66 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.47-3.59 (3H, m), 3.69-4.06 (3H, m), 4.45 (1H, d, J=13.9), 4.59 (1H, d, J=13.9), 4.65-4.68 (1H, m), 6.90-6.93 (1H, m), 7.12-7.19 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)
II-90		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.30-1.60 (8H, m), 1.72-1.83 (2H, m), 2.04 (2H, brs), 2.67 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.56 (2H, t, J=5.9), 3.93 (2H, brs), 4.51 (2H, s), 6.91-6.94 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m)

表 6 1

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-91		1.30-1.63 (8H, m), 1.75-1.82 (2H, m), 2.68 (2H, s), 3.93-3.96 (2H, m), 4.54 (2H, s), 5.17 (1H, dd, J=9.9, 1.3), 5.28-5.35 (1H, m), 5.86-6.01 (1H, m), 7.01-7.07 (2H, m), 7.20-7.23 (2H, m)
II-92	73.5-75.0	1.20 (6H, d, J=6.9), 1.58-1.67 (2H, m), 1.89-1.95 (2H, m), 2.73 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.6), 3.94 (2H, d, J=7.3), 4.66 (2H, s), 5.18 (1H, d, J=9.9), 5.29-5.36 (1H, m), 5.87-5.98 (1H, m), 7.15-7.19 (2H, m), 7.31-7.35 (1H, m)
II-93	127-128	1.21 (6H, d, J=6.6), 1.55-1.67 (2H, m), 1.89-1.97 (2H, m), 2.65 (3H, s), 2.74 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.6), 3.69-3.76 (4H, m), 4.69 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.30-7.35 (1H, m)
II-94		0.90 (6H, t, J=7.3), 1.20 (6H, d, J=7.3), 1.48-1.62 (4H, m), 2.69 (2H, s), 3.05 (1H, sept, J=7.3), 4.16 (2H, s), 4.38 (2H, s), 4.97 (1H, brs), 6.92-6.96 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.32-7.36 (1H, m)
II-95	98-99	1.23 (6H, s), 2.65 (2H, s), 4.00 (2H, d, J=6.9), 4.58 (2H, s), 5.19 (1H, d, J=6.9), 5.35 (1H, dd, J=17.2, 1.3), 5.90-6.03 (1H, m), 7.09 (1H, d, J=7.3), 7.42-7.53 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=8.2), 7.85 (1H, dd, J=7.3, 3.0), 8.05 (1H, d, J=6.9)
II-96	120-121	1.23 (6H, s), 1.49 (9H, s), 2.69 (2H, s), 4.01 (2H, s), 4.57 (2H, s), 7.11 (1H, d, J=8.2), 7.42-7.51 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=8.2), 7.84-7.87 (1H, m), 8.06 (1H, d, J=7.6)
II-97		1.23 (6H, s), 2.69 (2H, s), 3.40 (3H, s), 3.61-3.65 (2H, m), 4.15 (2H, s), 4.30-4.33 (2H, m), 4.56 (2H, s), 7.11 (1H, dd, J=7.3, 1.0), 7.42-7.54 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=8.2), 7.84-7.88 (1H, m), 8.04 (1H, dd, J=6.9, 3.3)
II-98	99-100	0.92 (6H, t, J=7.3), 1.22-1.60 (4H, m), 2.62 (2H, s), 4.00 (2H, s), 4.54 (2H, s), 5.19 (1H, d, J=9.9), 5.35 (1H, dd, J=17.2, 1.7), 5.93-6.03 (1H, m), 7.09 (1H, d, J=7.3), 7.42-7.52 (3H, m), 7.66 (1H, d, J=8.2), 7.83-7.86 (1H, m), 8.06 (1H, d, J=7.9)
II-99	111-113	0.90 (6H, t, J=6.9), 1.16-1.56 (4H, m), 1.49 (9H, s), 2.65 (2H, s), 4.02 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.10-7.12 (1H, m), 7.42-7.53 (3H, m), 7.66 (1H, d, J=8.2), 7.83-7.86 (1H, m), 8.05-8.08 (1H, m)
II-100	86-87	0.90 (6H, t, J=7.3), 1.43-1.66 (4H, m), 2.63 (2H, s), 4.00 (2H, d, J=6.9), 4.54 (2H, s), 5.20 (2H, d, J=9.9), 5.35 (1H, dd, J=16.8, 1.3), 5.90-6.05 (1H, m), 7.15-7.18 (1H, m), 7.38 (1H, dd, J=8.6, 4.3), 7.69 (1H, dd, J=8.6, 7.3), 7.92 (1H, d, J=8.6), 8.45 (1H, d, J=7.3), 8.93 (1H, dd, J=4.3, 1.7)

表 6 2

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-101	103-104	1.59-1.84 (8H, m), 2.74 (2H, s), 3.97 (2H, d, J=6.9), 4.61 (2H, s), 5.17 (1H, d, J=10.2), 5.32 (1H, dd, J=16.8, 1.3), 5.88-6.01 (1H, m), 7.08 (1H, d, J=8.2), 7.41-7.52 (3H, m), 7.60 (1H, d, J=8.2), 7.84 (1H, dd, J=7.3, 2.6), 8.02 (1H, d, J=6.6)
II-102		1.49 (9H, s), 1.54-1.90 (8H, m), 2.79 (2H, s), 4.00 (2H, s), 4.61 (2H, s), 7.11 (1H, dd, J=7.6, 1.3), 7.42-7.53 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=8.2), 7.84-7.89 (1H, m), 8.02-8.06 (1H, m)
II-103		1.58-1.85 (8H, m), 2.77 (2H, s), 3.99 (2H, d, J=7.3), 4.62 (2H, s), 5.19 (1H, d, J=8.9), 5.31-5.38 (1H, m), 5.91-6.04 (1H, m), 7.17 (1H, d, J=7.6), 7.39 (1H, dd, J=8.6, 4.3), 7.66-7.73 (1H, m), 7.93 (1H, d, J=8.6), 8.42 (1H, d, J=8.6), 8.93 (1H, dd, J=4.3, 2.0)
II-104	109-110	1.33-1.84 (10H, m), 2.66 (2H, s), 4.00 (2H, d, J=6.9), 4.63 (2H, s), 5.19 (1H, d, J=9.9), 5.35 (1H, dd, J=16.8, 1.3), 5.91-6.06 (1H, m), 7.10 (1H, d, J=7.3), 7.42-7.52 (3H, m), 7.66 (1H, J=8.2), 7.83-7.86 (1H, m), 8.06 (1H, d, J=7.3)
II-105		1.30-1.63 (8H, m), 1.72-1.84 (2H, m), 2.68 (2H, s), 4.00 (2H, d, J=6.9), 4.62 (2H, s), 5.20 (1H, d, J=9.9), 5.35 (1H, dd, J=16.8, 1.3), 5.92-6.04 (1H, m), 7.17 (1H, d, J=6.9), 7.38 (1H, dd, J=8.6, 4.3), 7.66-7.72 (1H, m), 7.93 (1H, d, J=8.6), 8.45 (1H, d, J=8.6), 8.93 (1H, dd, J=4.3, 1.7)
II-106		1.15 (6H, s), 1.22 (6H, d, J=6.9), 2.67 (2H, s), 3.02 (1H, sept, J=6.9), 4.08 (2H, s), 6.77-6.80 (1H, m), 7.07-7.18 (2H, m), 7.28-7.31 (1H, m), 7.77 (1H, dd, J=8.6, 2.6), 8.11 (1H, d, J=8.9), 8.57-8.58 (1H, m)
II-107	121.5-122.5	1.23 (6H, d, J=6.9), 1.27 (6H, s), 2.80 (2H, s), 3.17 (1H, sept, J=6.9), 4.36 (2H, s), 6.80-6.84 (1H, m), 7.13-7.23 (3H, m), 7.32-7.42 (2H, m), 7.70-7.79 (2H, m)
II-108	158.5-159.5	1.20 (6H, s), 1.27 (6H, d, J=6.9), 2.72 (2H, s), 3.29 (1H, sept, J=6.9), 3.99 (2H, s), 6.80-6.84 (1H, m), 7.09-7.39 (6H, m), 7.53-7.56 (1H, m)
II-109		1.16 (6H, s), 1.23 (6H, d, J=6.9), 2.67 (2H, s), 3.00 (1H, sept, J=6.9), 4.19 (2H, s), 6.79-6.83 (1H, m), 7.11-7.21 (2H, m), 7.30-7.34 (1H, m), 8.18 (1H, d, J=9.2), 8.32 (1H, dd, J=9.2, 2.6), 9.17 (1H, d, J=2.6)
II-110		0.94 (2H, t, J=7.3), 1.14 (6H, s), 1.57-1.71 (2H, m), 2.57 (2H, t, J=7.3), 2.67 (2H, s), 4.09 (2H, s), 6.81-6.87 (2H, m), 7.08-7.16 (2H, m), 7.75 (1H, dd, J=8.9, 2.6), 8.09 (1H, d, J=8.9), 8.55 (1H, s)

表 6 3

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CHCl ₃)
II-111		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.22 (6H, d, J=6.9), 1.42-1.52 (4H, m), 2.61 (2H, s), 3.06 (1H, sept, J=6.9), 4.11 (2H, s), 6.75-6.80 (1H, m), 7.07-7.18 (2H, m), 7.29-7.34 (1H, m), 7.75 (1H, dd, J=8.6, 2.6), 8.08 (1H, d, J=8.9), 8.57-8.58 (1H, m)
II-112		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.28 (6H, s), 2.85 (2H, s), 2.95 (1H, sept, J=6.9), 4.34 (2H, s), 6.72-6.79 (1H, m), 7.14-7.20 (2H, m), 7.31-7.36 (1H, m)
II-113	120-121	1.19 (6H, d, J=6.9), 1.58-1.66 (2H, m), 1.88-1.98 (2H, m), 2.38-2.60 (4H, m), 2.64 (3H, s), 2.69 (2H, s), 3.08 (1H, sept, J=6.9), 3.52 (2H, s), 4.59 (2H, s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.12-7.34 (8H, m)
II-114		0.89 (6H, t, J=7.3), 1.43-1.65 (4H, m), 2.49 (3H, s), 2.62 (2H, s), 3.93-3.96 (2H, m), 4.45 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.31 (1H, m), 5.89 (1H, m), 6.80 (1H, m), 6.91 (1H, m), 7.04 (1H, m), 7.24-7.30 (2H, m)
II-115		1.57-1.88 (8H, m), 2.49 (3H, s), 2.75 (2H, s), 3.95 (2H, m), 4.55 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.32 (1H, m), 5.93 (1H, m), 6.80 (1H, m), 6.91 (1H, m), 7.05 (1H, m), 7.29 (1H, m)
II-116		1.32-1.60 (8H, m), 1.72-1.84 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.66 (2H, s), 3.95 (2H, m), 4.54 (2H, s), 5.17 (1H, d, J=10.2), 5.32 (1H, dd, J=17.2, 1.3), 5.89 (1H, m), 6.80 (1H, m), 6.91 (1H, m), 7.04 (1H, m), 7.28 (1H, m)
II-117		1.65-1.86 (8H, m), 2.49 (3H, s), 2.75 (2H, s), 3.93 (2H, m), 4.54 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.31 (1H, m), 5.89 (1H, m), 6.96-7.01 (2H, m), 7.26-7.31 (2H, m)
II-118	111-112	1.37-1.63 (8H, m), 1.73-1.84 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.67 (2H, s), 3.94 (2H, m), 4.53 (2H, s), 5.17 (1H, d, J=10.2), 5.31 (1H, dd, J=17.2, 1.7), 5.92 (1H, m), 6.97-7.01 (2H, m), 7.26-7.30 (2H, m)
II-119		1.22 (6H, s), 1.25 (3H, t, J=6.9), 2.62 (2H, s), 2.65 (2H, q, J=6.9), 3.81 (3H, s), 3.95 (2H, m), 4.50 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.29 (1H, m), 5.94 (1H, m), 6.80-6.84 (2H, m), 6.93 (1H, m)
II-120		1.22 (6H, s), 1.24 (6H, d, J=6.9), 2.64 (2H, s), 2.89 (1H, sept, J=6.9), 3.82 (3H, s), 3.95 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.94 (1H, m), 6.89-6.94 (2H, m), 6.93 (1H, m)
II-121		1.18 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 2.64 (2H, s), 3.10 (1H, sept, J=6.9), 3.81 (3H, s), 3.95 (2H, m), 4.47 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.72 (1H, m), 6.85-6.95 (2H, m)
II-122		1.17 (6H, d, J=6.9), 1.22 (6H, s), 1.43 (3H, t, J=7.5), 2.65 (2H, s), 3.05 (1H, sept, J=6.9), 3.95 (2H, m), 4.05 (2H, q, J=7.5), 4.46 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.72 (1H, m), 6.85-6.90 (2H, m)

表 6 4

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-123		1.22 (6H, s), 1.45 (6H, t, J=7.4), 2.64 (2H, s), 3.95 (2H, m), 4.10 (4H, q, J=7.4), 4.48 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.55-6.63 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-124		1.05 (6H, t, J=7.4), 1.22 (6H, s), 1.78-1.86 (4H, m), 2.66 (2H, s), 3.93 (4H, q, J=7.4), 3.95 (2H, m), 4.48 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.55-6.68 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-125	86-88	1.23 (6H, s), 1.45 (3H, t, J=7.4), 2.67 (2H, s), 3.22 (3H, s), 3.95 (2H, m), 4.12 (2H, q, J=7.4), 4.47 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.95-6.99 (2H, m), 7.12 (1H, m).
II-126	65-66	1.22 (6H, s), 1.25 (3H, t, J=6.9), 2.65 (2H, s), 3.54 (2H, q, J=6.9), 3.95 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.99 (2H, d, J=7.9), 7.34 (2H, d, J=7.9).
II-127		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.45 (3H, t, J=7.4), 1.44-1.58 (4H, m), 2.62 (2H, s), 3.80 (3H, s), 3.95 (2H, m), 4.11 (2H, q, J=7.4), 4.45 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.50-6.65 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-128		0.88 (6H, t, J=7.4), 1.45 (6H, t, J=7.4), 1.44-1.58 (4H, m), 2.62 (2H, s), 3.95 (2H, m), 4.11 (4H, q, J=7.4), 4.45 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.55-6.65 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-129	62-64	0.88 (6H, t, J=7.4), 1.04 (3H, t, J=7.4), 1.43 (3H, t, J=7.4), 1.44-1.58 (4H, m), 1.86 (2H, sext, J=7.4), 2.62 (2H, s), 3.95 (2H, m), 3.98 (2H, t, J=7.4), 4.10 (2H, q, J=7.4), 4.49 (2H, s), 5.13 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.55-6.65 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-130	104-105	0.88 (6H, t, J=7.4), 1.06 (3H, t, J=7.4), 1.44-1.58 (4H, m), 1.86 (2H, sext, J=7.4), 2.62 (2H, s), 3.21 (3H, s), 3.95 (2H, m), 3.98 (2H, t, J=7.4), 4.43 (2H, s), 5.13 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.84-6.88 (2H, m), 7.13 (1H, m).
II-131	70-72	0.88 (6H, t, J=7.4), 1.04 (6H, t, J=7.4), 1.44-1.58 (4H, m), 1.86 (4H, m), 2.64 (2H, s), 3.95 (2H, m), 3.98 (2H, t, J=7.4), 4.49 (2H, s), 5.13 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.55-6.65 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-132	59-60	0.88 (6H, t, J=7.4), 1.04 (3H, t, J=7.4), 1.35 (6H, d, J=6.9), 1.44-1.58 (4H, m), 1.79 (2H, sext, J=7.4), 2.62 (2H, s), 3.95 (2H, m), 3.98 (2H, t, J=7.4), 4.46 (1H, sept, J=6.9), 4.46 (2H, s), 5.13 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.52-6.61 (2H, m), 6.88 (1H, m).
II-133		1.22 (6H, s), 2.30 (6H, s), 2.51-2.60 (2H, m), 2.65 (2H, s), 2.81-2.88 (2H, m), 3.95 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.98 (2H, d, J=7.9), 7.20 (2H, d, J=7.9).

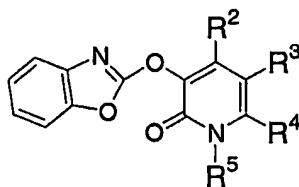
表 6 5

化合物番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-134		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.32-1.60 (8H, m), 1.47 (9H, s), 1.70-1.81 (2H, m), 2.70 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 3.97 (2H, s), 4.52 (2H, s), 6.95 (1H, m), 7.11-7.20 (2H, m), 7.31 (1H, m)
II-135		1.20 (6H, d, J=6.9), 1.58-1.68 (2H, m), 1.93-1.97 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.38-2.59 (4H, m), 2.64 (3H, s), 2.68 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.59 (2H, s), 6.91 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.33 (1H, m)
II-136		1.11 (3H, t, J=6.9), 1.20 (6H, d, J=6.9), 1.65-1.70 (2H, m), 1.94-2.00 (2H, m), 2.41-2.50 (4H, m), 2.56-2.69 (2H, m), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, s), 3.09 (1H, sept, J=6.9), 4.60 (2H, s), 6.91 (1H, m), 7.13-7.21 (2H, m), 7.33 (1H, m)
II-137	67-68	1.22 (6H, s), 2.65 (2H, s), 3.93-3.97 (2H, m), 4.45 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.85-6.91 (2H, m), 7.02 (1H, m).
II-138	80-82	1.22 (6H, s), 2.66 (2H, s), 3.95 (2H, m), 4.46 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.85 (1H, dd, J=8.2, 2.0), 7.16 (1H, d, J=2.0), 7.44 (1H, d, J=8.2).
II-139		1.22 (6H, s), 2.21 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.93-3.97 (2H, m), 4.51 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.85 (1H, d, J=8.2), 7.16 (1H, dd, J=8.2, 2.0), 7.22 (1H, d, J=2.0).
II-140		1.22 (6H, s), 2.30 (3H, s), 2.64 (2H, s), 3.95 (2H, m), 4.51 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.89 (1H, d, J=8.2), 7.16 (1H, dd, J=8.2, 2.0), 7.30 (1H, d, J=2.0).
II-141		1.22 (6H, s), 2.65 (2H, s), 2.88 (2H, t, J=7.1), 3.36 (3H, s), 3.66 (2H, t, J=7.1), 3.95 (2H, m), 4.49 (2H, s), 5.17 (1H, m), 5.28 (1H, m), 5.97 (1H, m), 6.98 (2H, d, J=8.3), 7.20 (2H, d, J=8.3).
II-142		1.25 (6H, d, J=6.9), 1.55-1.87 (8H, m), 2.72 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=6.9), 3.93 (2H, m), 4.54 (2H, s), 5.16 (1H, m), 5.30 (1H, m), 5.93 (1H, m), 6.95-7.00 (2H, m), 7.21-7.24 (2H, m)
II-143		1.25 (6H, d, J=6.9), 1.47 (9H, s), 1.63-1.85 (8H, m), 2.78 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=6.9), 3.95 (2H, s), 4.53 (2H,), 6.96-7.01 (2H, m), 7.20-7.24 (2H, m)

表 6 6

化合物 番号	物性	
No	融点	NMR (CDCl ₃)
II-144		0.88 (6H, t, J=7.3), 1.25 (6H, d, J=6.9), 1.43-1.68 (4H, m), 2.61 (2H, s), 2.90 (1H, sept, J=6.9), 3.94 (2H, m), 4.45 (2H, s), 5.15 (1H, m), 5.31 (1H, m), 5.94 (1H, m), 6.95-6.99 (2H, m), 7.20-7.24 (2H, m)
II-145		0.87 (6H, t, J=7.3), 1.25 (6H, d, J=6.9), 1.47 (9H, s), 1.48-1.70 (4H, m), 2.65 (2H, s), 2.90 (1H, sept, J=6.9), 3.96 (2H, s), 4.44 (2H, s), 6.97-7.01 (2H, m), 7.20-7.23 (2H, m)
II-146	90.5-92.5	1.25 (6H, d, J=6.9), 1.30-1.62 (8H, m), 1.73-1.85 (2H, m), 2.66 (2H, s), 2.91 (1H, sept, J=6.9), 3.94 (2H, m), 4.54 (2H, s), 5.16 (1H, dd, J=9.9, 1.3), 5.31 (1H, m), 5.94 (1H, m), 6.96-7.00 (2H, m), 7.20-7.24 (2H, m)
II-147		0.90 (6H, t, J=6.9), 1.15-1.57 (8H, m), 1.47 (9H, s), 2.64 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.96 (2H, s), 4.46 (2H, s), 6.92-6.97 (2H, m), 7.02 (1H, dd, J=7.9, 1.6), 7.13 (1H, m)
II-148		1.00 (6H, d, J=6.9), 1.06 (6H, d, J=6.9), 1.46 (9H, s), 2.01 (2H, sept, J=6.9), 2.80 (2H, s), 3.82 (3H, s), 3.87 (2H, s), 4.66 (2H, s), 6.91-7.01 (3H, m), 7.13 (1H, m)
II-149		0.92 (6H, t, J=7.3), 1.16-1.54 (8H, m), 2.61 (2H, s), 3.82 (3H, s), 3.94 (2H, dd, J=6.9, 1.0), 4.47 (2H, s), 5.16 (1H, m), 5.32 (1H, m), 5.94 (1H, m), 6.92-7.01 (3H, m), 7.13 (1H, m)
II-150		0.85 (3H, t, J=7.3), 1.18 (3H, d, J=6.9), 1.47-1.68 (4H, m), 1.90-2.00 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.39-2.63 (4H, m), 2.65 (3H, s), 2.69 (2H, d, J=2.3), 2.89 (1H, sext, J=7.3), 4.46 (1H, d, J=13.8), 4.71 (1H, d, 13.8), 6.92 (1H, m), 7.12-7.29 (3H, m)
II-151		1.37-1.63 (8H, m), 1.48 (9H, s), 1.70-1.83 (2H, m), 2.67 (2H, s), 4.02 (2H, s), 4.62 (2H, s), 7.11 (1H, dd, J=7.6, 1.3), 7.42-7.53 (3H, m), 7.67 (1H, d, J=8.2), 7.85 (1H, dd, J=6.9, 3.3), 8.07 (1H, m)
II-152		0.88 (6H, t, J=7.3), 1.44-1.65 (4H, m), 1.49 (9H, s), 2.65 (2H, s), 4.02 (2H, s), 4.54 (2H, s), 7.11 (1H, dd, J=7.3, 1.0), 7.42-7.53 (3H, m), 7.67 (1H, J=8.2), 7.85 (1H, dd, J=5.6, 3.3), 8.07 (1H, dd, J=7.3, 3.3)
II-153		1.21 (6H, d, J=6.9), 1.58-1.67 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.41-2.45 (4H, m), 2.67 (2H, s), 3.13 (1H, sept, J=6.9), 3.89 (2H, s), 6.80 (1H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.31 (1H, m)
II-154		0.85 (3H, t, J=7.3), 1.19 (3H, d, J=7.3), 1.47-1.81 (6H, m), 2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.40-2.50 (4H, m), 2.67 (2H, s), 2.92 (1H, sext, J=7.3), 3.84 (1H, d, J=13.9), 6.80 (1H, m), 7.11-7.17 (2H, m), 7.25 (1H, m)

表 6 7




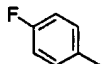

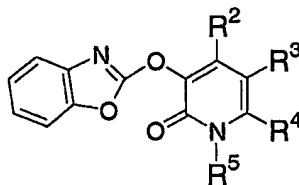
化合物 No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
1-001	H	Me	Me	Me	2.16 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 7.17-7.26 (m, 2H), 7.34 (s, 1H), 7.34-7.43 (m, 1H), 7.46-7.50 (m, 1H).
1-002	H	Me	Me	Et	1.32 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.19 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.34 (s, 1H), 7.39-7.42 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H).
1-003	H	Me	Me	nPr	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.65-1.78 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.03-4.08 (m, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 7.38-7.41 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H).
1-004	H	Me	Me	nBu	0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.62-1.72 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.19-7.25 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 7.38-7.42 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H).
1-005	H	Me	Me	Bn	2.14 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 5.42 (br s, 2H), 7.17-7.51 (m, 10H).
1-006	H		H	nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 2H), 7.22-7.28 (m, 3H), 7.34-7.51 (m, 7H), 7.81 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H).
1-007	H		H	nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.10-7.17 (m, 2H), 7.22-7.24 (m, 3H), 7.37-7.44 (m, 3H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H).
1-008	H		H	nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.49 (m, 2H), 1.79-1.87 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.23-7.27 (m, 2H), 7.37-7.44 (m, 2H), 7.45-7.52 (m, 1H), 7.50 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.75-7.78 (m, 1H), 7.81 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (d, <i>J</i> = 3.7 Hz, 1H), 8.74 (s, 1H).

表 6 8

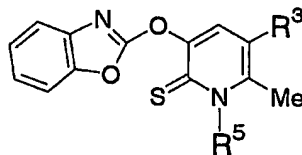


化合物 No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
1-009	H		H	nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.38-1.48 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 2H), 6.92 (s, 1H), 7.23-7.52 (m, 6H), 7.67-7.69 (m, 2H), 7.71 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H).
1-010	Me	H	Me	nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 5.95 (s, 1H), 7.18 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.8 Hz), 7.23 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.8 Hz, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.47 (m, 1H).
1-011		H	Me	nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 1.73 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 3H), 3.32 (s, 2H), 3.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.82 (s, 1H), 4.88 (s, 1H), 6.13 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.17 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.19 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.5 Hz, 1H), 7.23 (ddd, <i>J</i> = 7.5, 7.5, 1.5 Hz, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.48 (m, 1H).

表 6 9

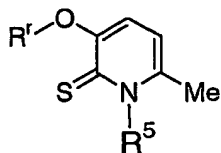
化合物 No.	構造	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3)
1-012		2.16 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 7.20-7.29 (m, 2H), 7.40-7.44 (m, 1H), 7.58-7.61 (m, 1H), 7.83 (s, 1H).
1-013		0.95 (t, $J = 7.2$ Hz), 1.35-1.48 (m, 2H), 1.60-1.72 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.11 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.22-7.29 (m, 2H), 7.41-7.44 (m, 1H), 7.57-7.61 (m, 1H), 7.81 (s, 1H).
1-014		0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 6H), 1.30-1.60 (m, 4H), 1.60-1.75 (m, 2H), 1.76-1.90 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 3.89 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.02 (t, $J = 8.1$ Hz, 2H), 5.88 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 6.52 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H).
1-015		0.94 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.40 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.74 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 1.87 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.58 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.69 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.02 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.16-7.26 (m, 2H), 7.24 (s, 1H), 7.40 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.48 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.4 Hz, 1H).
1-016		0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.42 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.76 (m, 4H), 1.81 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.43 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 5.07 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 7.28-7.39 (m, 1H), 7.34 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.45 (d, $J = 7.5$ Hz, 2H).
1-017		3.23 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.24 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 6.10 (t, $J = 6.9$ Hz, 1H), 6.99 (dd, $J = 1.8, 6.9$ Hz, 1H), 7.08-7.29 (m, 5H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.49-7.52 (m, 2H), 7.56 (dd, $J = 1.2, 7.8$ Hz, 1H).
1-018		3.03 (t, $J = 6.1$ Hz, 2H), 4.34 (t, $J = 6.1$ Hz, 2H), 6.74 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.19-7.45 (m, 6H), 7.50 (d, $J = 6.4$ Hz, 1H), 7.61 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.73 (d, $J = 7.3$ Hz, 1H).
1-019		0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.58-1.73 (m, 4H), 1.81 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.45 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.18 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.00 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.07 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 6.34 (s, 1H), 7.21-7.33 (m, 5H).

表 7 0



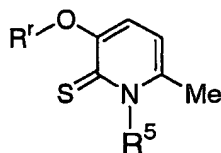
化合物 No.	R ³	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
2-001	Me	Me	2.28 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H).
2-002	Me	Et	1.46 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 4.92 (br s, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.37 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-003	Me	nPr	1.04 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.89 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.71 (br s, 2H), 7.19-7.26 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-004	Me	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.83 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.80 (br s, 2H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-005	Me	iBu	0.97-0.99 (m, 6H), 2.27 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 2.51-2.66 (m, 1H), 3.81 (br s, 1H), 5.64 (br s, 1H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.39 (s, 1H), 7.42-7.48 (m, 2H).
2-006	Me	nPent	0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 4H), 1.85 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.76 (br s, 2H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-007	Me	nHexyl	0.89 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 6H), 1.84 (br s, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.79 (br s, 2H), 7.17-7.26 (m, 2H), 7.35 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-008	Me	Bn	2.24 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 6.27 (br s, 2H), 7.14-7.52 (m, 10H).
2-009	Et	Me	1.23 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 3H), 2.50 (s, 3H), 2.61 (q, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.17 (s, 3H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-010	Et	Et	1.23 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.47 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 2.57 (s, 3H), 2.59 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.92 (br s, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.39 (s, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H).
2-011	Et	nPr	1.04 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.22 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.89 (br s, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.59 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.72 (br s, 2H), 7.18-7.24 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-012	Et	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.22 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.83 (br s, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.59 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.77 (br s, 2H), 7.20-7.24 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H).
2-013	Et	Bn	1.22 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.57 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.26 (br s, 2H), 7.13-7.51 (m, 10H).

表 7 1



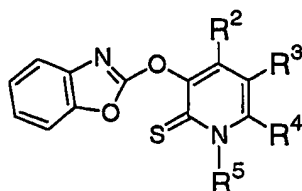
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
2-014		Me	2.55 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 6.57 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.40-7.50 (m, 3H).
2-015		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.84 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 4.69 (br s, 2H), 6.52 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.30-7.50 (m, 3H).
2-016		nBu	0.82 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.32 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.47-1.52 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.37 (br s, 2H), 4.80 (s, 2H), 7.06 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.38-7.44 (m, 1H), 7.60-7.67 (m, 1H).
2-017	Ac	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.88 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.54 (s, 3H), 4.70 (br s, 2H), 6.44 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.04 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
2-018	H	nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 3H), 1.50 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.80-1.90 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.66 (br s, 2H), 6.49 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.91 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.44 (br s, 1H).
2-019		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.61 (brs, 2H), 6.38 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.97 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
2-020	H ₃ C-SO ₂ -	nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.49 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.82 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 3.48 (dd, <i>J</i> = 3.0, 1.5 Hz, 3H), 4.70 (brs, 2H), 6.47 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.31 (dd, <i>J</i> = 7.8, 1.8 Hz, 1H).
2-021		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.81 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.00 (s, 2H), 4.67 (brs, 2H), 6.39 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 6.98 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.10-7.50 (m, 5H).
2-022		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.90-3.00 (m, 2H), 3.10-3.20 (m, 2H), 4.70 (brs, 2H), 3.10-3.20 (m, 2H), 4.70 (brs, 2H), 6.42 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.97 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.18-7.34 (m, 5H).

表 7 2



化合物 No.	R'	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
2-023		nBu	0.92 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.37 (m, 4H), 2.41 (s, 3H), 4.17 (brs, 2H), 4.47 (s, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.00-7.30 (m, 5H).
2-024		nBu	0.94 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.40 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.70 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.89 (s, 6H), 4.60 (br s, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 7.21 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.51 (dd, <i>J</i> = 8.1, 7.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, <i>J</i> = 8.4, 7.8 Hz, 1H), 8.28 (dd, <i>J</i> = 7.2, 0.9 Hz, 1H), 8.61 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H).
2-025		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.50 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.80-1.85 (m, 2H), 2.51 (s, 3H), 4.67 (br s, 2H), 6.51 (dd, <i>J</i> = 5.1, 4.8 Hz, 1H), 6.57 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.38 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.70-7.85 (m, 2H).
2-026	nBu	nBu	0.90-1.03 (m, 6H), 1.4-1.6 (m, 4H), 1.8-1.9 (m, 4H), 2.50 (s, 3H), 3.98 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.76 (brs, 2H), 6.40 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.60 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
2-027		nBu	0.91 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25-1.44 (m, 4H), 1.25-1.44 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.18 (brs, 2H), 4.44 (s, 2H), 6.73 (A ₂ B ₂ -type, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 7.09 (A ₂ B ₂ -type, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.25 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
2-028	EtO ₂ C-	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.84 (m, 2H), 2.55 (s, 3H), 4.35 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.69 (brs, 2H), 6.45 (dd, <i>J</i> = 7.5, 0.6 Hz, 1H), 7.12 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
2-029		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 4.73 (brs, 2H), 6.48 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20-7.70 (m, 3H), 8.20-8.30 (m, 2H).

表 7 3



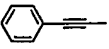
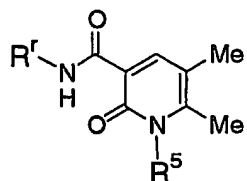
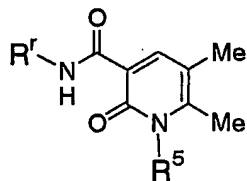
化合物 No.	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
2-030	H	H	H	iPr	1.45 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 6.31-6.45 (m, 1H), 6.76 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.03-7.29 (m, 3H), 7.43-7.29 (m, 3H), 7.43-7.54 (m, 2H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 1.5, 7.0 Hz, 1H).
2-031	Me	H	H	nPr	1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.83-2.02 (m, 2H), 4.48 (t, <i>J</i> = 7.7 Hz, 2H), 6.56 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.20-7.28 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.57 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
2-032	-CH ₂ OMe	H	H	nPr	0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.35-1.47 (m, 2H), 1.81-1.91 (m, 2H), 3.43 (s, 3H), 4.48-4.56 (m, 3H), 6.89 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 6.97-7.48 (m, 4H), 7.68 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H).
2-033	H	H	H	nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.83-1.94 (m, 2H), 4.57 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 6.65-6.70 (m, 1H), 7.22-7.27 (m, 2H), 7.43-7.51 (m, 3H), 7.68 (dd, <i>J</i> = 1.5, 6.4 Hz, 1H).
2-034	Me	H	H	nBu	0.95 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.79-1.90 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.51 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 2H), 6.55 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.20-7.28 (m, 2H), 7.43-7.48 (m, 2H), 7.59 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
2-035	H	Me	H	nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.46 (m, 2H), 1.82-1.92 (m, 2H), 4.54 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.19-7.27 (m, 2H), 7.40-7.52 (m, 4H).
2-036	H	Br	H	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.83-1.93 (m, 2H), 4.53 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.21-7.30 (m, 2H), 7.42-7.52 (m, 2H), 7.64 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 7.79 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H).
2-037	H		H	nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 1.85-1.97 (m, 2H), 4.57 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.22-7.28 (m, 2H), 7.34-7.44 (m, 3H), 7.44-7.52 (m, 4H), 7.61 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H).

表 7 4



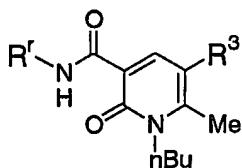
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-001		Me	2.20 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 10.28 (br s, 1H).
3-002		Me	2.19 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.62 (s, 3H), 3.65-3.72 (m, 2H), 7.21-7.33 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 9.99 (br s, 1H).
3-003		Et	1.32 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.20 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-004		Et	1.33 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.64-3.71 (m, 2H), 4.21 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
3-005		nPr	1.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 3H), 1.65-1.78 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.07 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-006		nPr	1.05 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.67-1.80 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.92-2.97 (m, 2H), 3.64-3.72 (m, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.35 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.05 (br s, 1H).
3-007		iPr	1.60 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.34 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
3-008		iPr	1.62 (s, 3H), 1.64 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.93 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.64 (br s, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-009		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-010		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).

表 7 5



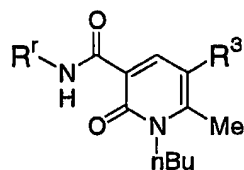
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-011		nHexyl	0.89 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 6H), 1.60-1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H).
3-012		nHexyl	0.91 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 6H), 1.63-1.70 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-013		Bn	2.19 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 5.44 (br s, 2H), 7.07-7.38 (m, 10H), 8.44 (s, 1H), 10.24 (br s, 1H).
3-014		Bn	2.18 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.64-3.71 (m, 2H), 5.45 (br s, 2H), 7.08-7.36 (m, 10H), 8.41 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).
3-015		Ph	2.00 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 4.58 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.15-7.32 (m, 7H), 7.49-7.58 (m, 3H), 8.49 (s, 1H), 10.02 (br s, 1H).
3-016		Ph	2.00 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.88 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.59-3.66 (m, 2H), 7.16-7.29 (m, 7H), 7.51-7.61 (m, 3H), 8.46 (s, 1H), 9.82 (br s, 1H).

表 7 6



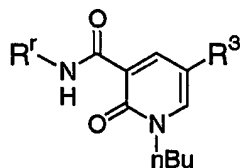
化合物 No.	R ¹	R ³	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-033		nBu	0.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.51 (m, 6H), 1.61-1.69 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.48 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
3-034		nBu	0.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.54 (m, 6H), 1.63-1.72 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.48 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (m, 2H), 3.62-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.32 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-035		nPentyl	0.90 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.53 (m, 8H), 1.62-1.69 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.48 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
3-036		nPentyl	0.90 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28-1.39 (m, 4H), 1.40-1.55 (m, 4H), 1.62-1.72 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.47 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.32 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).
3-037		I	0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 4.16 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.37 (m, 5H), 8.78 (s, 1H), 10.4 (br s, 1H).
3-038		I	1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.59 (s, 3H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.92 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.17 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.19-7.33 (m, 5H), 8.74 (s, 1H), 9.77 (br s, 1H).
3-039			1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.41-1.53 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.45 (m, 10H), 8.46 (s, 1H), 10.25 (br s, 1H).
3-040			1.02 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.16 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.19-7.45 (m, 10H), 8.43 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).

表 7 7



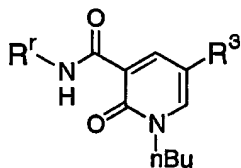
化合物 No.	R ^r	R ^s	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-044		CF ₃	1.02 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.64-3.69 (m, 2H), 4.14 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.69 (s, 1H), 9.61 (brs, 1H).

表 7 8



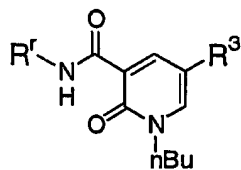
化合物 No.	R ¹	R ³	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-061	n-Hexyl		0.86-0.91 (m, 6H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.26-1.47 (m, 16H), 1.54-1.65 (m, 4H), 1.73-1.83 (m, 2H), 3.38-3.45 (m, 4H), 4.07 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 6.72 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 8.40 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.83 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 9.69 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).
3-062			1.02 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.58 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 4H), 6.81 (br s, 1H), 7.24-7.36 (m, 10H), 7.42 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.78 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.00 (br s, 1H).
3-063			0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.33-1.46 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 2.88-2.94 (m, 4H), 3.63-3.72 (m, 4H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.20-7.34 (m, 10H), 8.37 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.65 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 9.52 (br s, 1H).
3-064			0.91-0.96 (m, 6H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.44 (m, 4H), 1.54-1.65 (m, 6H), 1.71-1.81 (m, 2H), 3.38 (br s, 4H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.23-7.39 (m, 5H), 7.85 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.58 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.04 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).
3-065			0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.15-1.49 (m, 6H), 1.64-1.81 (m, 6H), 1.96-2.05 (m, 2H), 3.87-3.99 (m, 1H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.10 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 6.92-7.38 (m, 5H), 8.38 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.72 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.05 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
3-066			0.89 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.27-1.45 (m, 8H), 1.54-1.63 (m, 2H), 1.73-1.82 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 3.38-3.45 (m, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 6.44 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.20-7.34 (m, 5H), 8.39 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.74 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 9.78 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).

表 7 9



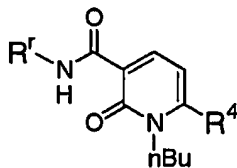
化合物 No.	R ^r	R ^s	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-067		I	0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.31-1.44 (m, 2H), 1.68-1.78 (m, 2H), 3.95 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.23-7.36 (m, 5H), 7.70 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 8.67 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 10.03 (br s, 1H).
3-068			0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.67 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.50 (m, 10H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.87 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.25 (br s, 1H).
3-069			0.98 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.23-7.40 (m, 8H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.73 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.66 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.03 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
3-070	nBuO	H	0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.73-1.79 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.24 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.53 (dd, <i>J</i> = 6.7, 2.1 Hz, 1H), 8.14 (dd, <i>J</i> = 7.5, 2.4 Hz, 1H).
3-071		H	0.95 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.36 (sextet, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 1.66-1.80 (m, 2H), 3.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.60 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.36 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 7.46 (dd, <i>J</i> = 6.3, 2.1 Hz, 1H), 8.47 (dd, <i>J</i> = 7.2, 2.4 Hz, 1H).
3-072		CF ₃	0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.47 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.66-3.73 (m, 2H), 7.20-7.34 (m, 5H), 7.83 (m, 1H), 8.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 9.62 (br s, 1H).
3-073			0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.66-3.73 (m, 2H), 4.07 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.19-7.31 (m, 6H), 7.34 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 7.42 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 7.65 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.63 (dd, <i>J</i> = 2.7, 0.6 Hz, 1H), 9.89 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).

表 8 0



化合物 No.	R ^f	R ³	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-074			1.00 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.70-1.87 (m, 2H), 2.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.69-3.76 (m, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 6.58 (brs, 1H), 7.20-7.34 (m, 6H), 7.44-7.47 (m, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.89 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 10.11 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).

表 8 1



化合物 No.	R ^r	R ⁴	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-081		Me	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.05 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.27 (dd, <i>J</i> = 7.2, 6.6 Hz, 1H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.41 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 10.2 (br s, 1H).
3-082		nPentyl	0.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 6H), 1.62-1.70 (m, 4H), 2.67 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 10.21 (br s, 1H).
3-083		nPentyl	0.93 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.49 (m, 6H), 1.63-1.70 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.68 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.40 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 9.94 (br s, 1H).
3-084		nHexyl	0.91 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30-1.50 (m, 8H), 1.60-1.72 (m, 4H), 2.67 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 6.28 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 10.21 (br s, 1H).
3-085		nHexyl	0.91 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31-1.49 (m, 8H), 1.61-1.71 (m, 4H), 2.67 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.41 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 9.94 (t, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H).

表 8 2

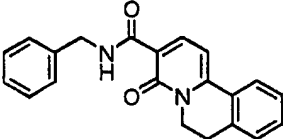
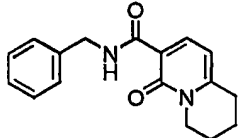
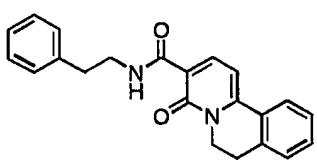
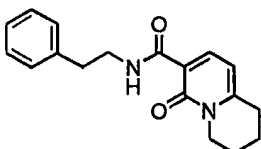
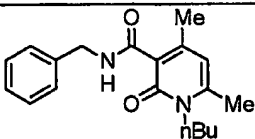
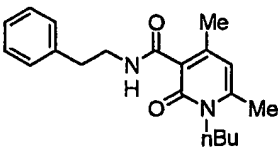
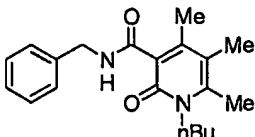
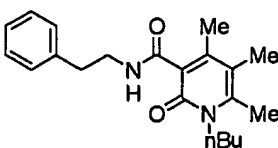
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-101		3.03 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.35 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.94 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.23-7.49 (m, 8H), 7.81 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 8.63 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 10.22 (br s, 1H).
3-102		1.79-1.88 (m, 2H), 1.95-2.03 (m, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.26 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.46 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 10.19 (br s, 1H).
3-103		2.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.68-3.75 (m, 2H), 4.35 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.19-7.35 (m, 5H), 7.37-7.43 (m, 3H), 7.80 (dd, <i>J</i> = 1.5, 7.3 Hz, 1H), 8.59 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 9.93 (br s, 1H).
3-104		1.79-1.88 (m, 2H), 1.95-2.04 (m, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 6.24 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.42 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 9.90 (br s, 1H).
3-105		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 3.91 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 6.05 (s, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H).
3-106		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.72 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 2.93 (t-like, 2H), 3.63 (t-like, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 6.04 (s, 1H), 7.17-7.33 (m, 5H).
3-107		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.72 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.62 (s, 2H), 7.20-7.42 (m, 5H), 9.02 (br s, 1H).
3-108		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.72 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.67 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.07 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.34 (m, 5H), 8.47 (br s, 1H).

表 8 3

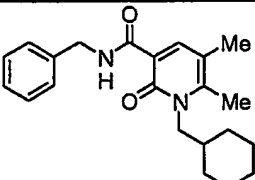
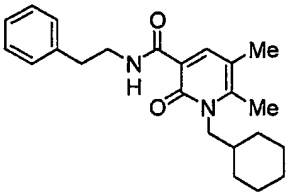
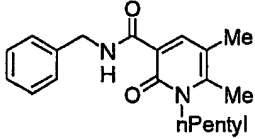
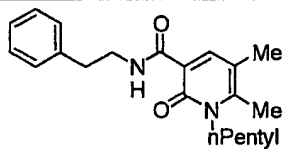
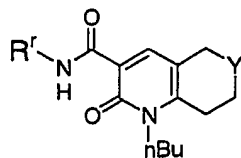
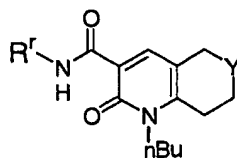
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
3-109		1.00-1.28 (m, 4H), 1.56-1.90 (m, 7H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.00 (br s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.3 (br s, 1H).
3-110		1.00-1.30 (m, 4H), 1.58-1.90 (m, 7H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.01 (br s, 2H), 7.18-7.35 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.3 (br s, 1H).
3-111		0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.42 (m, 4H), 1.60-1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.3 (br s, 1H).
3-112		0.94 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.42 (m, 4H), 1.60-1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.60-3.70 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.35 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).

表 8 4



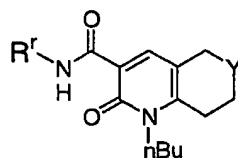
化合物 No.	R ^r	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-001		-CH ₂ -	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.32 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-002		-CH ₂ -	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.05 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-003		-CH ₂ -	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.73 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.60 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.65 (dd, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2.1 Hz, 2H), 7.05 (dd, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2.1 Hz, 2H), 8.23 (s, 1H), 10.01 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-004		-CH ₂ -	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.70 (q, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 8.22 (s, 1H), 8.51 (br s, 2H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-005		-CH ₂ -	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.91 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.09 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.34 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.34 (s, 1H), 12.18 (br s, 1H).

表 8 5



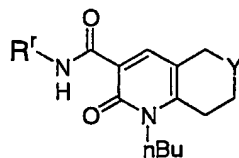
化合物 No.	R ^r	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-006		-CH ₂ -	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.53 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.02 (s, 2H), 6.74 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 6.81 (dd, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1.8 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 10.26 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-007		-CH ₂ -	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.73 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 6.25 (dd, <i>J</i> = 3.0 Hz, 0.9 Hz, 1H), 6.28-6.31 (m, 1H), 7.35 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 10.25 (br t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).

表 8 6



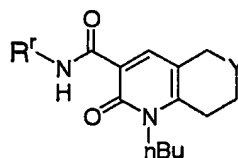
化合物 No.	R ^r	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-008		-CH ₂ -	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.59 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.26 (s, 2H), 7.28 (s, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.35 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-009		-CH ₂ -	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.78 (s, 3H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.57 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.85 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.29 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.24 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-010		-O-	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.22 (s, 1H), 10.22 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-011		-O-	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 7.18-7.36 (m, 5H), 8.19 (s, 1H), 9.96 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-012		-O-	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.61 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.61 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.59 (s, 2H), 6.71 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.07 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.17 (s, 1H), 9.92 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 8 7



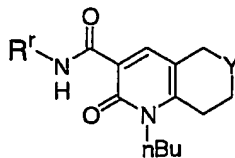
化合物 No.	R ^f	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-013			0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.73 (m, 2H), 2.78 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 2.84 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 3.48 (s, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.26-7.37 (m, 10H), 8.21 (s, 1H), 10.24 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-014			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.78 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 2.85 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.48 (s, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 10H), 8.18 (s, 1H), 9.99 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 8 8



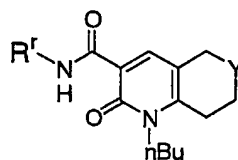
化合物 No.	R ^f	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-015			0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.77 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.19 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.86 (s, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.38 (m, 5H), 8.24 (s, 1H), 10.27 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-016			0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.19 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.86 (s, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.21 (s, 1H), 10.01 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-017			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.80 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.35 (m, 5H), 7.43-7.51 (m, 5H), 8.10 (s, 1H), 10.16 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-018			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.55-1.90 (m, 10H), 2.84 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.52 (s, 2/3 × 2H), 4.59 (s, 1/3 × 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.39 (m, 5H), 8.31 (s, 2/3 × 1H), 8.33 (s, 1/3 × 1H), 10.20 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 8 9



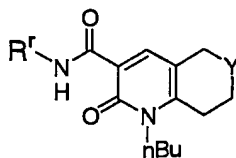
化合物 No.	R ^r	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-019			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.84 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.77 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.47 (s, 2/3 × 2H), 4.58 (s, 1/3 × 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.39 (m, 5H), 8.30 (s, 2/3 × 1H), 8.33 (s, 1/3 × 1H), 10.19 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-020			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.29 (s, 9H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.62 (s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.20 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 0



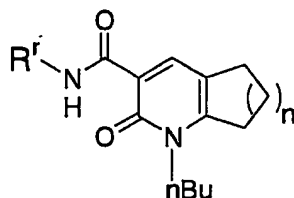
化合物 No.	R'	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-021			0.88 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1/3 × 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2/3 × 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 2.99 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 3.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.40 (s, 1/3 × 2H), 4.62 (s, 2/3 × 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.38 (m, 7H), 8.11 (s, 2/3 × 1H), 8.39 (s, 1/3 × 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 10.12 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-022			1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6.9 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.48 (br s, 2/3 × 2H), 4.68 (br s, 1/3 × 2H), 7.20-7.32 (m, 5H), 7.44-7.51 (m, 5H), 8.08 (br s, 2/3 × 1H), 8.37 (br s, 1/3 × 1H), 9.89 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-023			0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.88 (m, 10H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.68 (dt, <i>J</i> = 6.6 Hz, 7.2 Hz, 2H), 3.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.52 (s, 2/3 × 2H), 4.58 (s, 1/3 × 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.27 (s, 2/3 × 1H), 8.30 (s, 1/3 × 1H), 9.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 1



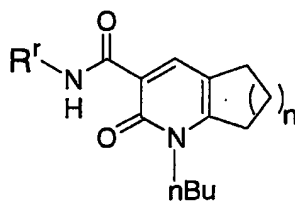
化合物 No.	R ^r	Y	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-024			0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.37 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.84 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.68 (q, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 3.77 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.47 (s, 2/3 × 2H), 4.58 (s, 1/3 × 2H), 7.20-7.33 (m, 5H), 8.27 (s, 2/3 × 1H), 8.30 (s, 1/3 × 1H), 9.81 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1/3 × 1H), 9.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2/3 × 1H).
4-025			1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.30 (s, 9H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.68 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.62 (s, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 9.94 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-026			0.88 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1/3 × 3H), 1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2/3 × 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.82-3.01 (m, 4H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.07 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.39 (br s, 2/3 × 2H), 4.73 (br s, 1/3 × 2H), 7.20-7.37 (m, 7H), 8.07 (s, 2/3 × 1H), 8.35 (s, 1/3 × 1H), 8.76 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 9.85 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 2



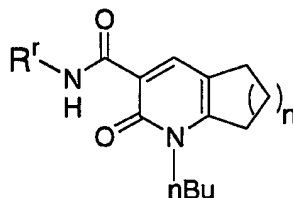
化合物 No.	R ^f	n	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-051		1	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.19 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.39 (m, 5H), 8.46 (s, 1H), 10.31 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-052		1	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.19 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.43 (s, 1H), 10.05 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-053		3	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 4H), 1.68 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.22-7.38 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.31 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-054		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.67 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.66 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.19-7.34 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.05 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-055		3	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58-1.65 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.59 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.99 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.32 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 10.32 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-056		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.66 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.63 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.97 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 7.20 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.04 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 3



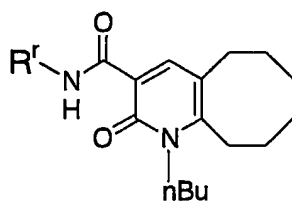
化合物 No.	R ^r	n	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-057		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.68 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.63 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.22 (br s, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.06 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 4



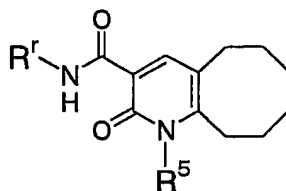
化合物 No.	R ^r	n	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-058		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.68 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.60 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.40 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.00 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-059		3	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56-1.68 (m, 4H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.48 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.05 (br s, 1H), 6.53 (br s, 1H), 6.74 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 10.35 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-060		3	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56-1.69 (m, 4H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.70 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.00 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.44 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-061		6	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.26-1.34 (m, 4H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.46-1.60 (m, 4H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.80 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.41 (m, 5H), 8.38 (s, 1H), 10.36 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-062		6	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.24-1.33 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.47-1.58 (m, 4H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.80 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.86 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.21-7.34 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 5



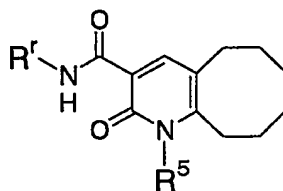
化合物 No.	R ^r	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-101		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.53 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.78 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.17-7.39 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.34 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-102		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.34 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.07 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-103		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.58 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.59-1.74 (m, 4H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.64 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.98 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.21 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.06 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-104		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.73 (m, 4H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.61 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.64 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.02 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-105		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.72 (m, 4H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.63 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 7.08 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 10.10 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 6



化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-301			1.36 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.49 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.61-1.68 (m, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.67 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.32 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.26-7.40 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.25 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-302			1.38 (quint, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 1.49 (quint, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 1.60-1.67 (m, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.67 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 3.68 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.33 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 7.24-7.34 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 9.98 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
4-303			0.99 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 6H), 1.32-1.82 (m, 11H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.98-4.20 (br s, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.23-7.40 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.3 (t-like).
4-304			(CD ₃ OD): 1.24-1.57 (m, 2H), 1.64-1.85 (m, 2H), 2.70 (t-like, 2H), 2.94 (t-like, 2H), 3.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.41 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.61 (s, 2H), 7.22-7.40 (m, 7H), 8.44 (A ₂ B ₂ , <i>J</i> = 5.2 Hz), 8.26 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 1H).
4-305			1.32-1.82 (m, 14H), 2.38-2.53 (m, 4H), 2.57 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.26 (t-like, 1H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.22-7.39 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H).
4-306			1.32-1.50 (m, 4H), 1.52-1.72 (m, 4H), 2.17 (quint, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 2.52-2.70 (m, 4H), 3.98-4.10 (m, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.98 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.22-7.40 (m, 5H), 7.54 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 10.19 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).

表 9 7



化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-307			1.34-1.54 (m, 4H), 1.60-1.81 (m, 4H), 1.82-1.94 (m, 2H), 2.28-2.50 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.70 (t, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 4.17 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.20-7.39 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.29 (t-like, 1H).
4-308			1.30-1.42 (m, 2H), 1.42-1.52 (m, 2H), 1.60-1.80 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.79 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 3.01 (t, <i>J</i> = 7.7 Hz, 2H), 4.31 (t, <i>J</i> = 7.7 Hz, 2H), 4.87 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.14-7.28 (m, 2H), 7.30-7.42 (m, 4H), 7.57 (ddd, <i>J</i> = 6.0, 1.9, 1.9 Hz, 2H), 8.38 (s, 1H), 8.51 (d-like, 2H), 10.3 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
4-309			1.37-1.53 (m, 4H), 1.60-1.80 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.81 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.64 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 5.44 (br s, 2H), 7.20-7.42 (m, 7H), 8.45 (s, 1H), 8.45-8.58 (m, 2H), 10.1 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
4-310			1.35-1.55 (m, 4H), 1.60-1.80 (m, 4H), 2.68 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 4.62 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 5.42 (br s, 2H), 6.97 (A ₂ B ₂ , <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 7.19-7.37 (m, 5H), 8.47 (s, 1H), 8.54-8.58 (m, 2H), 10.1 (t-like, 1H).

表 9 8

化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-311		0.99 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.36-1.75 (m, 12H), 2.62 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.08 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.14-7.42 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.35 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-312		0.99 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.36-1.75 (m, 12H), 2.62 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.08 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.14-7.42 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.35 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-313		0.98 (t, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.40-1.76 (m, 12H), 1.42 (s, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 2H), 3.19 (s, 2H), 4.07 (brs, 2H), 7.16-7.26 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 9.87 (s, 1H).
4-314		0.98 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.39-1.76 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.93 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.5 Hz, 1H), 3.97 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.9 Hz, 1H), 4.10 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.27-7.46 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
4-315		0.98 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.39-1.76 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.93 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.5 Hz, 1H), 3.97 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.9 Hz, 1H), 4.10 (brs, 2H), 5.31 (m, 1H), 7.27-7.46 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
4-316		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.76 (m, 12H), 2.63 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.12 (brs, 2H), 5.54 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-317		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32-1.76 (m, 12H), 2.63 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.12 (brs, 2H), 5.54 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
4-318		0.97 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.38-1.75 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 2.99 (dd, <i>J</i> = 16.0, 6.6 Hz, 2H), 3.41 (dd, <i>J</i> = 16.0, 7.5 Hz, 2H), 4.07 (brs, 2H), 4.88 (m, 1H), 7.15-7.24 (m, 4H), 8.32 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 9 9

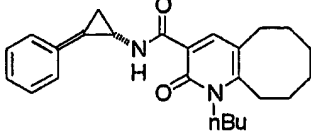
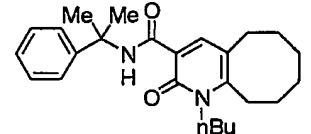
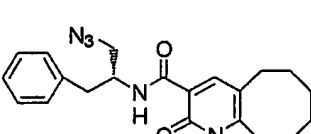
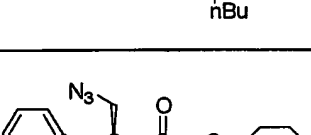
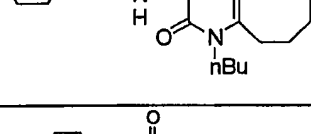
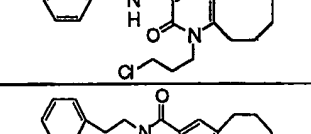
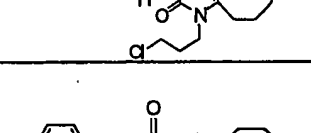
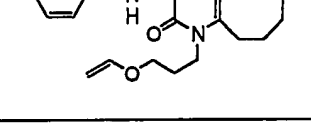
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-319		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.25-1.77 (m, 12H), 2.18 (m, 1H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.89 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 3.14 (m, 1H), 4.10 (brs, 2H), 7.16-7.30 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.12 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H).
4-320		1.00 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.30-1.55 (m, 6H), 1.59 (s, 6H), 1.56-1.89 (m, 6H), 2.58 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.00-4.23 (m, 2H), 7.10-7.40 (m, 5H), 7.46 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 8.23 (s, 1H).
4-321		1.35-2.04 (m, 8H), 2.03-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88-2.96 (m, 4H), 3.63-3.71 (m, 2H), 3.78 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.05 (dd, $J = 6.9, 2.1$ Hz, 2H), 4.18-4.27 (m, 3H), 6.49 (dd, $J = 14.1, 6.6$ Hz, 1H), 7.15-7.35 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.01 (brs, 1H).
4-322		1.35-2.04 (m, 8H), 2.03-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88-2.96 (m, 4H), 3.63-3.71 (m, 2H), 3.78 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.05 (dd, $J = 6.9, 2.1$ Hz, 2H), 4.18-4.27 (m, 3H), 6.49 (dd, $J = 14.1, 6.6$ Hz, 1H), 7.15-7.35 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.01 (brs, 1H).
4-323		1.20-1.90 (m, 8H), 2.13-2.28 (m, 2H), 2.55-2.72 (m, 2H), 2.82-3.02 (m, 2H), 3.62-3.78 (m, 2H), 4.20-4.38 (m, 2H), 4.64 (d, $J = 6.3$ Hz, 2H), 7.18-7.43 (m, 5H), 8.36 (s, 1H).
4-324		1.20-1.90 (m, 8H), 2.12-2.28 (m, 2H), 2.65 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.92-3.02 (m, 4H), 3.60-3.78 (m, 4H), 4.29 (t, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.10-7.40 (m, 5H), 8.33 (s, 1H).
4-325		1.37-1.80 (m, 8H), 2.02 (m, 2H), 2.65 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 2.92 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 3.77 (t, $J = 5.4$ Hz, 2H), 4.04 (dd, $J = 6.9, 2.1$ Hz, 1H), 4.16-4.26 (m, 3H), 4.65 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 6.48 (dd, $J = 14.1, 6.6$ Hz, 1H), 7.21-7.42 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.29 (brs, 1H).
4-326		1.37 (m, 8H), 2.07 (m, 2H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.90-2.96 (m, 4H), 3.63-3.71 (m, 2H), 3.78 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.05 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.1 Hz, 1H), 4.18-4.27 (m, 3H), 6.49 (dd, $J = 14.1, 6.6$ Hz, 1H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.01 (brs, 1H).

表 100

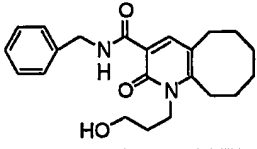
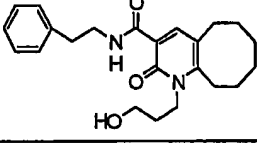
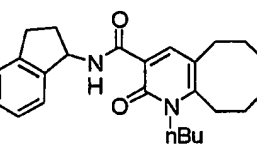
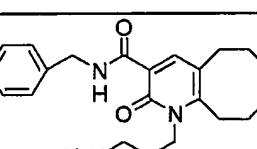
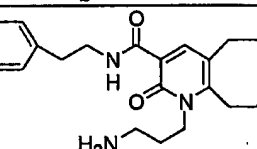
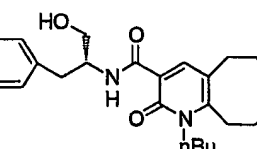
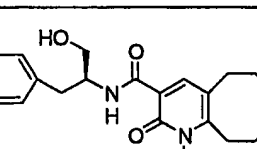
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-327		1.38-1.81 (m, 8H), 1.88-1.96 (m, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.52 (t, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 3.72 (brs, 1H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.22-7.38 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.18 (brs, 1H).
4-328		1.38-1.95 (m, 10H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90-2.94 (m, 4H), 3.45-3.52 (m, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 3.91 (brs, 1H), 4.34 (brs, 2H), 7.20-7.35 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 9.88 (brs, 1H).
4-329		0.96 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.30-1.55 (m, 6H), 1.55-1.82 (m, 6H), 1.97 (ddd, <i>J</i> = 16.5, 12.9, 8.4 Hz, 1H), 2.60-2.73 (m, 3H), 2.84-2.96 (m, 3H), 3.03 (ddd, <i>J</i> = 16.5, 9.3, 3.6 Hz, 1H), 3.93-4.20 (m, 2H), 5.67 (q-like, 1H), 7.10-7.35 (m, 3H), 7.38 (m, 1H), 8.37 (s, 1H).
4-330		1.25-1.28 (m, 14H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.80 (brs, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.22 (m, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.24-7.39 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.25 (brs, 1H).
4-331		1.37-1.90 (m, 12H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.80 (m, 2H), 2.90-2.96 (m, 4H), 3.68 (q, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.23 (brs, 2H), 7.21-7.33 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 9.98 (brs, 1H).
4-332		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.54 (m, 6H), 1.55-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.98 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.66 (dd, <i>J</i> = 10.1, 6.3 Hz, 1H), 3.79 (dd, <i>J</i> = 10.1, 3.6 Hz, 1H), 4.33 (m, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H).
4-333		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.54 (m, 6H), 1.55-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.98 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.66 (dd, <i>J</i> = 10.1, 6.3 Hz, 1H), 3.79 (dd, <i>J</i> = 10.1, 3.6 Hz, 1H), 4.33 (m, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H).

表 1 0 1

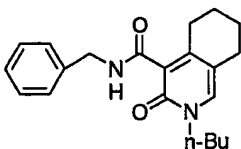
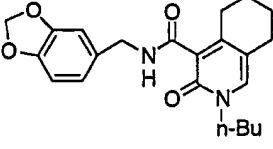
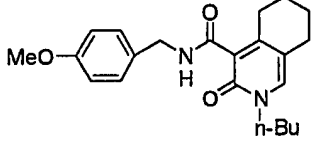
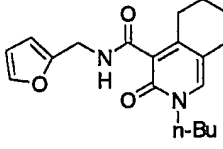
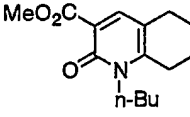
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-501		0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66-1.77 (m, 6H), 2.57 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.27 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.92 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.60 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.23-7.40 (m, 5H), 9.58 (br t, $J = 5.7$ Hz, 1H).
4-502		0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.66-1.77 (m, 6H), 2.56 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.27 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.92 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.92 (s, 2H), 6.75 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 6.83 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 6.88 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 9.58 (br s, 1H).
4-503		0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.65-1.77 (m, 6H), 2.56 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.27 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.91 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.53 (s, 2H), 6.86 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.12 (s, 1H), 7.30 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 9.54 (br s, 1H).
4-504		0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.37 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.66-1.78 (m, 6H), 2.56 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.27 (br t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 3.92 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 4.58 (s, 2H), 6.27 (dd, $J = 3.0$ Hz, 0.9 Hz, 1H), 6.30 (dd, $J = 3.0$ Hz, 1.8 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.35 (dd, $J = 1.8$ Hz, 0.9 Hz, 1H), 9.65 (br s, 1H).
4-505		0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.43 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.87 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.57 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.73 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.02 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 7.92 (s, 1H).

表 1 0 2

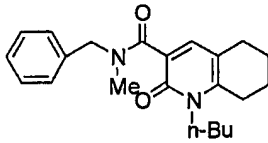
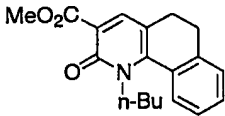
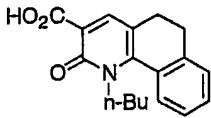
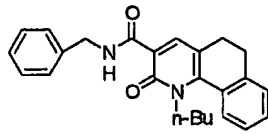
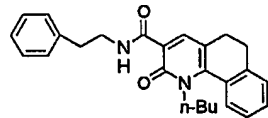
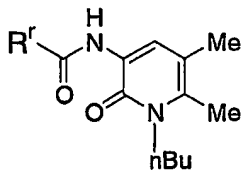
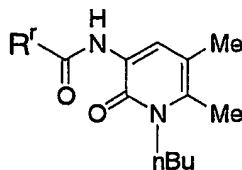
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
4-506		0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.42 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.77 (m, 4H), 1.84 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.54 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.70 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.88 (s, 3H), 4.02 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.75 (s, 2H), 7.17-7.40 (m, 6H). (minor isomer): δ 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.77 (m, 4H), 1.83 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.50 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.68 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.97 (s, 3H), 4.01 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 7.17-7.40 (m, 6H).
4-507		0.89 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.30 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.92 (quint, $J = 6.9$ Hz, 2H), 2.57, 2.77 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.58, 2.76 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.93 (s, 3H), 4.30 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.31-7.41 (m, 3H), 7.56 (dd, $J = 7.2$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H).
4-508		0.91 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.30 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.91 (quint, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.65, 2.80 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.66, 2.79 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.42 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.38-7.46 (m, 3H), 7.57 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 14.77 (br s, 1H).
4-509		0.88 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.27 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.87 (quint, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.62, 2.78 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.64, 2.76 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.35 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 4.68 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 7.21-7.41 (m, 8H), 7.53 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 10.33 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).
4-510		0.90 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.29 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.87 (quint, $J = 6.6$ Hz, 2H), 2.62, 2.78 (ABq, $J = 9.0$ Hz, 2H), 2.63, 2.76 (ABq, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 3.66-3.74 (m, 2H), 4.36 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.19-7.37 (m, 8H), 7.53 (dd, $J = 6.9$ Hz, 2.4 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 10.06 (br t, $J = 6.0$ Hz, 1H).

表 103



化合物 No.	R ^r	¹ H-NMR (CDCl ₃)
5-001	Me	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 8.20 (s, 1H), 8.35 (br s, 1H).
5-002		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.14 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.44-7.57 (m, 3H), 7.92-7.95 (m, 2H), 8.41 (s, 1H), 9.22 (br s, 1H).
5-003		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.15-7.24 (m, 1H), 7.30 (dd, 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.47-7.54 (m, 1H), 8.12 (dt, 1.8, 7.8 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 9.75 (br s, 1H).
5-004		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.63-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.12-7.18 (m, 2H), 7.93-7.97 (m, 2H), 8.37 (s, 1H), 9.16 (br s, 1H).
5-005		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.64-1.72 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.31-7.47 (m, 3H), 7.73 (dd, <i>J</i> = 2.1, 7.2 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 9.13 (br s, 1H).
5-006		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.32-7.37 (m, 1H), 7.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.74 (br s, 1H).
5-007		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.35 (m, 2H), 7.74 (m, 2H), 8.41 (s, 1H), 9.21 (br s, 1H).
5-008		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.27 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.84 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.40 (s, 1H), 9.20 (br s, 1H).
5-009		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.20-7.27 (m, 1H), 7.41-7.48 (m, 1H), 7.63-7.70 (m, 2H), 8.38 (s, 1H), 9.19 (br s, 1H).
5-010		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.12 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.46-7.59 (m, 3H), 7.79 (dd, <i>J</i> = 1.2, 7.2 Hz, 1H), 7.88 (dd, 1.5, 7.2 Hz, 1H), 7.95 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.45 (dd, <i>J</i> = 1.5, 7.5 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.95 (br s, 1H).
5-011		1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.66-1.76 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.16 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.53-7.62 (m, 2H), 7.88-8.03 (m, 4H), 8.47 (s, 2H), 9.41 (br s, 1H).

表 104

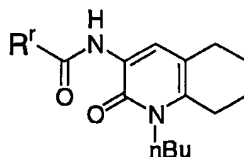


化合物 No.	R'	¹ H-NMR (CDCl ₃)
5-012		0.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.47 (m, 2H), 1.57-1.67 (m, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.72 (s, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.28-7.40 (m, 5H), 8.22 (s, 1H), 8.40 (br s, 1H).
5-013		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.69 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.17-7.34 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 8.35 (br s, 1H).
5-014		0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31-1.39 (m, 2H), 1.51-1.62 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.54-7.64 (m, 3H), 7.83 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 13.06 (br s, 1H).
5-015	nBuO-	0.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.49 (m, 4H), 1.60-1.70 (m, 4H), 2.11 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.15 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 7.73 (br s, 1H), 7.85 (br s, 1H).
5-016		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.41 (m, 5H), 7.88 (s, 1H), 8.09 (br s, 1H).
5-017	BnO-	0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.48 (m, 2H), 1.59-1.69 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 7.26-7.41 (m, 5H), 7.83 (s, 1H), 7.86 (s, 1H).
5-018		0.90 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27-1.40 (m, 2H), 1.57-1.67 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.91-6.97 (m, 1H), 7.28-7.34 (m, 1H), 7.49 (br s, 1H), 7.50-7.54 (m, 1H), 8.08-8.11 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.38 (br s, 1H).
5-019		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.61-1.71 (m, 2H), 2.15 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.98-7.03 (m, 1H), 7.25-7.30 (m, 2H), 7.41-7.45 (m, 2H), 8.03 (s, 1H).
5-020		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.75 (m, 4H), 2.12 (s, 3H), 4.27 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.48-7.61 (m, 3H), 8.04-8.09 (m, 3H), 8.98 (s, 1H), 10.35 (br s, 1H).

表 1 0 5

化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
5-101		0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.49 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.51 (s, 2H), 6.27 (s, 1H), 7.30-7.35 (m, 2H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.69-7.72 (m, 1H).
5-102		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.59-1.69 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.23-7.43 (m, 1H), 7.42-7.43 (m, 4H), 8.86 (s, 1H).
5-103		0.92 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25-1.37 (m, 2H), 1.45-1.55 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 3.97 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.35 (s, 1H), 7.41-7.55 (m, 2H), 7.65 (br s, 1H), 7.83-7.87 (m, 2H).
5-104		0.95 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.45 (m, 2H), 1.59-1.70 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.03 (s, 1H), 7.28-7.44 (m, 6H), 7.79-7.82 (m, 4H).
5-105		0.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.11 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.72-7.77 (m, 2H), 7.88-7.94 (m, 2H).
5-106		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.64-1.75 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.38-7.50 (m, 3H), 7.89-7.92 (m, 2H), 9.57 (s, 1H), 10.60 (br s, 1H).

表 106



化合物 No.	R ^f	¹ H-NMR (CDCl ₃)
6-001		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.66 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.43-7.56 (m, 3H), 7.94 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.26 (br s, 1H).
6-002		0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56-1.65 (m, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.82 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.52 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.72 (s, 2H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.27-7.39 (m, 5H), 8.13 (s, 1H), 8.44 (br s, 1H).
6-003		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.71 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.84 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.55 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 8.15 (s, 1H), 8.41 (br s, 1H).
6-004		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.72 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.85 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 7.03 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.32 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 3H), 8.19 (s, 1H), 9.49 (br s, 1H).
6-005		0.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.32 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.65 (m, 2H), 1.69 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.82 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.55 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.59 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.46 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.72 (br s, 1H), 7.24-7.32 (m, 5H), 7.95 (s, 1H), 8.00 (br s, 1H).
6-006		(in <i>d</i> ₆ -DMSO): 0.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.56 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 1.71-1.80 (m, 2H), 2.51 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.27 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.84 (s, 1H), 8.53 (br s, 1H), 9.51 (br s, 1H).
6-007		0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.83 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.53 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 7.29-7.41 (m, 5H), 7.76 (s, 1H), 7.86 (br s, 1H).

表 107

化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
7-001		0.71 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.10-1.23(m, 2H), 1.46-1.55(m, 2H), 2.22(s, 3H), 2.43(s, 3H), 4.28 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.20-7.29(m, 2H), 7.38-7.41(m, 1H), 7.58-7.60(m, 1H), 7.67(s, 1H).
7-002		0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.60-1.80 (m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.48 (s, 3H), 4.71 (br s, 2H), 7.30-7.35 (m, 3H), 8.01 (s, 1H), 8.04 (s, 1H).
7-003		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.96 (s, 1H).
7-004		2.07 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 5.42 (br s, 2H), 7.19-7.54 (m, 9H).
7-005		1.10 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.53 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H), 5.41 (br s, 2H), 7.18-7.55 (m, 9H).
7-006		0.84 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.68 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.42 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 5H), 8.32 (br s, 1H), 8.42 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
7-007		0.95 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 3.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.50 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.60 (d, 5.7 Hz, 1H), 5.9 (brs, 1H), 6.36 (brs, 1H), 6.56 (dd, <i>J</i> = 9.6, 3.6 Hz, 1H), 7.25-7.36 (m, 5H), 7.86 (m, 1H), 8.22 (m, 2H).
7-008		0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.45 (m, 2H), 1.69-1.79 (m, 2H), 3.96 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 4.44 (s, 2H), 7.19-7.30 (m, 3H), 7.40-7.43 (m, 1H), 7.59-7.62 (m, 1H), 7.66 (dd, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H).
7-009		0.96 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.32-1.44 (m, 2H), 1.68-1.79 (m, 2H), 3.96 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 6.14 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.06-7.27 (m, 5H), 7.39 (dd, <i>J</i> = 1.8, 7.0 Hz, 1H).

表 1 0 8

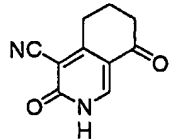
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
7-010		(in CDCl ₃ + CD ₃ OD): 2.17 (quint, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.09 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 8.34 (s, 1H).

表 109

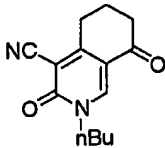

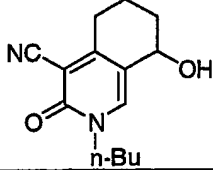
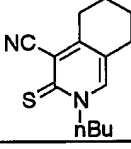
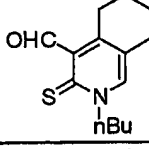
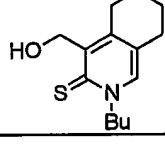
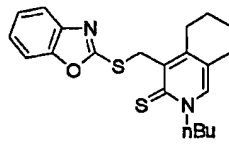

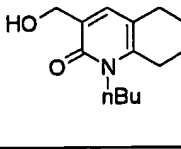
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
7-011		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.15 (quint, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.06 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).
7-012		0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.67-1.86 (m, 6H), 2.54 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.22 (s, 1H).
7-013		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.15 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.45-3.58 (m, 1H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.39 (s, 1H).
7-014		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.75-1.90 (m, 6H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.81 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.50 (s, 1H).
7-015		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 3.3 Hz, 4H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.62 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.95 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.51 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.53 (s, 1H), 10.60 (s, 1H).
7-016		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.71-1.95 (m, 6H), 2.66 (br t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.58 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.79 (s, 2H), 7.61 (s, 1H).
7-017		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70-1.95 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.01 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.58 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.05 (s, 2H), 7.15-7.30 (m, 2H), 7.42 (dd, <i>J</i> = 7.2 Hz, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.48 (br s, 1H), 7.60 (dd, <i>J</i> = 7.2 Hz, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H).
7-018		0.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.32 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.42-1.59 (m, 5H), 1.88 (s, 1H), 1.97-2.08 (m, 2H), 2.20-2.32 (m, 1H), 2.54-2.66 (m, 1H), 3.06-3.19 (m, 2H), 3.33-3.43 (m, 3H).
7-019		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.71 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.85 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.52 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.53 (s, 2H), 7.02 (s, 1H).

表 1 1 0

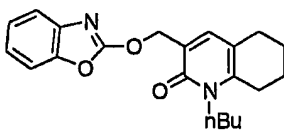
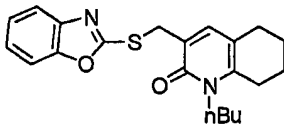
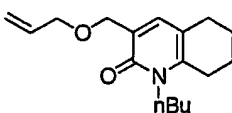
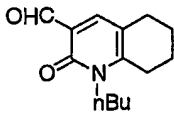
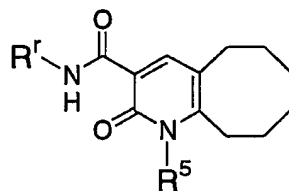
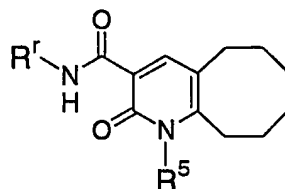
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
7-020		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.57-1.72 (m, 4H), 1.81 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.45 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.93 (s, 2H), 7.08-7.30 (m, 4H), 7.13 (s, 1H).
7-021		0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.59-1.73 (m, 4H), 1.81 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.49 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 7.24 (quint d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1.5 Hz, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.42 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1.5 Hz, 1H), 7.60 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1.5 Hz, 1H).
7-022		0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.70 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.84 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.53 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.99 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.12 (dt, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1.5 Hz, 2H), 4.46 (s, 2H), 5.20 (dq, <i>J</i> = 10.5 Hz, 1.8 Hz, 1H), 5.33 (dq, <i>J</i> = 17.1 Hz, 1.8 Hz, 1H), 5.91-6.05 (m, 1H), 7.19 (s, 1H).
7-023		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.68 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.74 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.88 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.59 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.76 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.76 (s, 1H), 10.34 (s, 1H).

表 1 1 1



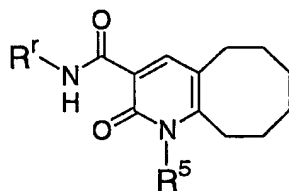
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-001		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.22-1.53 (m, 6H), 1.62-1.86 (m, 6H), 2.36-2.42 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.48 (dt, <i>J</i> = 7.2, 6.9 Hz, 2H), 3.72 (t, <i>J</i> = 4.8 Hz, 4H), 4.05-4.14 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.1 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).
10-002		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.05-4.20 (m, 2H), 4.80 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 2H), 7.16 (m, 1H), 7.35 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.64 (ddd, <i>J</i> = 7.8, 7.8, 1.8 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.59 (dlike, 1H), 10.6 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).
10-003		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 6H), 1.60-1.90 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.70 (dt, <i>J</i> = 7.5, 6.0 Hz, 2H), 4.03-4.14 (m, 2H), 7.18-7.20 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 8.50-8.52 (m, 2H), 10.1 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).
10-004		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.62-1.85 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.12 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.28 (A2B2, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 8.53 (s, 1H), 8.54 (A2B2, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 10.5 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
10-005		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.60-1.82 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.68 (dt, <i>J</i> = 7.5, 6.3 Hz, 2H), 4.04-4.14 (m, 2H), 7.23 (dd, <i>J</i> = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 7.59 (ddd, <i>J</i> = 7.8, 2.1, 1.5 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.47 (dd, <i>J</i> = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 10.1 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
10-006		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 6H), 1.41 (s, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.16 (s, 2H), 4.06 (br.s, 2H), 6.88-6.94 (m, 2H), 7.11-7.16 (m, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.83 (br.s, 1H).

表 1 1 2



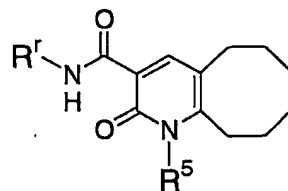
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-007		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.49 (m, 6H), 1.51-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.10 (br.s, 2H), 4.73 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 7.16-7.25 (m, 4H), 7.35 (m, 1H), 7.46 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.4 (br.s, 1H).
10-008		nBu	0.98 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.48 (m, 6H), 1.51-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.09 (m, 2H), 4.65 (d, <i>J</i> = 5.8 Hz, 2H), 6.85-6.93 (m, 2H), 7.22 (dt, <i>J</i> = 7.6, 1.8 Hz, 1H), 7.35 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.8 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.3 (br.s, 1H).
10-009		nBu	0.97 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 6H), 1.60-1.80 (m, 6H), 2.38 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.08 (m, 2H), 4.63 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 2H), 7.15-7.20 (m, 3H), 7.33 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 10.2 (br.s, 1H).
10-010		nBu	0.97 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.50 (m, 6H), 1.61-1.78 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 4.08 (br.s, 2H), 4.72 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 2H), 6.84-6.92 (m, 2H), 7.20 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.2 (br.s, 1H).
10-011		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.71 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.43 (dt, <i>J</i> = 8.1 Hz, 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.70 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.74 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-012		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.56 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.06 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.15 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.25 (dt, <i>J</i> = 7.8 Hz, 6.0 Hz, 1H), 7.35-7.42 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.67 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).

表 1 1 3



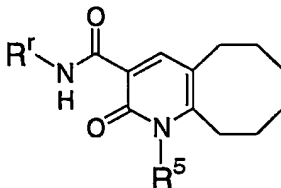
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-013		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.55 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.01 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.78-3.06 (m, 4H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.35-4.45 (m, 1H), 7.18-7.30 (m, 5H), 8.24 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-014		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.55 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.79 (m, 6H), 1.97 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.70-3.81 (m, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.31-5.39 (m, 1H), 6.61 (br t, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 7.28-7.44 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.66 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-015		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.57 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (s, 3H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.60 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.38 (dt, <i>J</i> = 7.5 Hz, 6.0 Hz, 1H), 7.35-7.43 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
10-016		nBu	0.99 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 6H), 1.62-1.82 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.06-4.17 (m, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 7.28 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 7.41 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.5 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H).
10-017		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.35-1.57 (m, 6H), 1.65-1.85 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 4.08-4.20 (m, 2H), 6.33 (s, 1H), 6.48 (dd, <i>J</i> = 3.4, 1.8 Hz, 1H), 6.68 (d, <i>J</i> = 3.4 Hz, 1H), 7.46 (m, 1H), 8.35 (s, 1H), 12.8 (s, 1H).

表 1 1 4



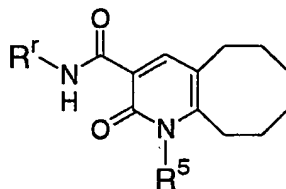
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-018		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.57 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.23-3.33 (m, 1H), 3.45-3.55 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.40-4.50 (m, 1H), 4.53 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.14-5.30 (m, 2H), 5.52 (br s, 1H), 5.82-5.96 (m, 1H), 7.17-7.28 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-019		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40 (s, 9H), 1.41-1.55 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88-3.00 (m, 2H), 3.18-3.28 (m, 1H), 3.38-3.48 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.37-4.47 (m, 1H), 5.11 (br s, 1H), 7.22-7.32 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.13 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-020		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.81 (m, 12H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74-3.04 (m, 6H), 3.21-3.37 (m, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.44-4.53 (m, 1H), 5.06-5.17 (m, 2H), 5.08-5.95 (m, 1H), 7.18-7.29 (m, 5H), 8.25 (s, 1H), 10.17 (br s, 1H).
10-021		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95-3.11 (m, 2H), 3.49-3.59 (m, 1H), 3.68-3.76 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.51-4.64 (m, 1H), 7.17-7.85 (m, 10H), 7.92 (br s, 1H), 8.27 (s, 1H), 10.45 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-022		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.57 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96-3.12 (m, 2H), 3.46-3.56 (m, 1H), 3.70-3.79 (m, 1H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.51-4.63 (m, 1H), 7.17-7.39 (m, 6H), 8.17 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.37 (br s, 1H), 8.69 (d, <i>J</i> = 3.9 Hz, 1H), 9.07 (br s, 1H), 10.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 1 1 5



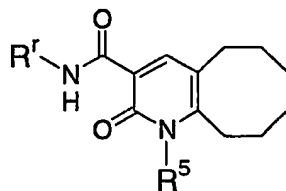
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-023		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.59 (m, 4H), 1.50 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.85 (m, 6H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.46-7.61 (m, 3H), 8.11 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.42 (s, 1H), 13.76 (br s, 1H).
10-024	H-	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.56 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.81 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.69 (br s, 1H), 8.30 (s, 1H), 9.63 (br s, 1H).
10-025		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.84 (m, 12H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.13 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.50-7.53 (m, 3H), 8.00-8.08 (m, 2H), 8.37 (s, 1H), 13.04 (br s, 1H).
10-026		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.57 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.87 (m, 6H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.40-7.56 (m, 3H), 7.95 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.42 (s, 1H), 14.37 (br s, 1H).
10-027		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.56 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.82 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 6.12 (br s, 1H), 7.39-7.51 (m, 3H), 7.75-7.79 (m, 2H), 8.12 (s, 1H).
10-028		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.58 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.60-1.82 (m, 6H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.06 (s, 3H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.36-7.56 (m, 3H), 7.52-7.57 (m, 2H), 8.23 (s, 1H), 12.43 (br s, 1H).
10-029		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.55 (m, 4H), 1.40 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.60-1.83 (m, 6H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.30 (q, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 7.32-7.40 (m, 3H), 7.51-7.61 (m, 2H), 8.23 (s, 1H), 12.44 (br s, 1H).

表 1 1 6



化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-030			1.37-1.53 (m, 4H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.61-1.79 (m, 4H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 5.30 (quint, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 5.42 (br s, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 7.25-7.41 (m, 5H), 8.43 (s, 1H), 8.58 (br s, 2H), 10.11 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-031			1.37-1.80 (m, 8H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.07 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 3.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.30 (q, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 5.45 (br s, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 7.29-7.42 (m, 5H), 8.44 (s, 1H), 8.57 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 10.50 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-032		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.58 (m, 6H), 1.60-1.80 (m, 6H), 1.92-2.05 (m, 1H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.95 (m, 1H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.95-4.16 (m, 2H), 5.68 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.15-7.29 (m, 3H), 7.36-7.40 (m, 1H), 8.37 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-033		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 6H), 1.59-1.79 (m, 6H), 1.91-2.04 (m, 1H), 2.62-2.72 (m, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.95 (m, 1H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.98-4.18 (m, 2H), 5.68 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.15-7.26 (m, 3H), 7.36-7.40 (m, 1H), 8.37 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-034		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.56 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.83 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.82 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 6.90 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.22-7.27 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 11.48 (br s, 1H).
10-035		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.20-1.53 (m, 12H), 1.59-1.80 (m, 8H), 1.95-2.01 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91-4.02 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.88 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-036		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.13-1.30 (m, 2H), 1.36-1.83 (m, 21H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.28 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).

表 1 1 7



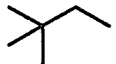
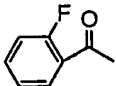
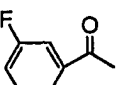
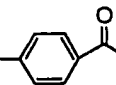
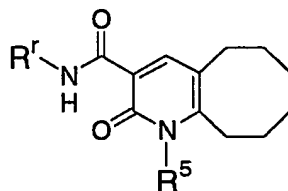
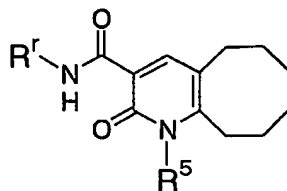
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-037	Me	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 6H), 1.62-1.81 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 3H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.85 (br s, 1H).
10-038	Et	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.24 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.42-3.51 (m, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.90 (br s, 1H).
10-039	iPr	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 6H), 1.34-1.52 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.60-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.25 (sextet, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.82 (br s, 1H).
10-040	tBu	nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 6H), 1.47 (s, 9H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.92 (br s, 1H).
10-041		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.01 (s, 9H), 1.36-1.57 (m, 6H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.27 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 10.10 (br s, 1H).
10-042		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.15-7.30 (m, 2H), 7.47-7.56 (m, 1H), 7.96 (td, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1.5 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 13.37 (br s, 1H).
10-043		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40-1.58 (m, 6H), 1.67-1.85 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.25-7.32 (m, 1H), 7.47-7.55 (m, 1H), 7.80 (dt, <i>J</i> = 9.6 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.89 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 13.84 (br s, 1H).
10-044		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.62 (m, 6H), 1.65-1.89 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.20 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 2H), 8.11-8.16 (m, 2H), 8.42 (s, 1H), 13.79 (br s, 1H).

表 1 1 8



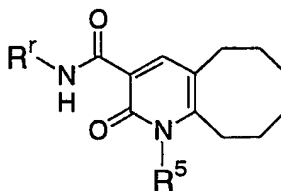
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-045		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.96 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.34-7.44 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 13.18 (br s, 1H).
10-046		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.56 (m, 6H), 1.67-1.85 (m, 6H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.32 (dt, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1.2 Hz, 1H), 7.86-8.01 (m, 2H), 8.41 (s, 1H), 13.88 (br s, 1H).
10-047		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.57 (m, 6H), 1.63-1.82 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.25 (s, 1H), 13.37 (br s, 1H).
10-048		nBu	1.03 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.55 (m, 6H), 1.68-1.87 (m, 6H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.20 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.57 (s, 2H), 14.30 (br s, 1H).
10-049		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.01-1.34 (m, 6H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.37-1.57 (m, 8H), 1.62-1.88 (m, 9H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.99-4.10 (m, 2H), 4.05-4.21 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 9.88 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
10-050		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.01-1.32 (m, 6H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.34-1.52 (m, 8H), 1.62-1.86 (m, 9H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.01-4.11 (m, 2H), 4.05-4.22 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 9.88 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-051		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.55 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65-1.82 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 2H), 7.47-7.63 (m, 3H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.31 (s, 1H), 10.81 (br s, 1H).
10-052		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.28-1.55 (m, 12H), 1.59-1.80 (m, 10H), 1.99 (br s, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.47 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.27 (br s, 1H).

表 1 1 9



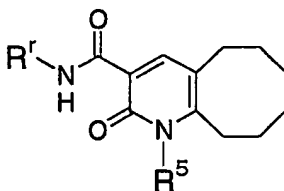
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-053		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.80 (m, 14H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.00 (br s, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.94 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.63 (br s, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.97 (br s, 1H).
10-054		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.79 (m, 10H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.79 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.13 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.52-5.59 (m, 1H), 7.26-7.45 (m, 5H), 8.32 (br s, 1H), 10.80 (br s, 1H).
10-055		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.79 (m, 10H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.03 (dd, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2.4 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.47 (q, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 5H), 8.28 (s, 1H), 10.82 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-056		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.79 (m, 12H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04, 3.21 (ABx, <i>J</i> = 16.2 Hz, 3.0 Hz, 2H), 4.07 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.74-4.80 (m, 1H), 5.56 (dd, <i>J</i> = 7.2 Hz, 5.1 Hz, 1H), 7.20-7.30 (m, 3H), 7.34-7.39 (m, 1H), 8.35 (s, 1H), 10.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-057		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.81 (m, 12H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04, 3.21 (ABx, <i>J</i> = 16.2 Hz, 3.0 Hz, 2H), 4.07 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.77 (sextet, <i>J</i> = 3.0 Hz, 1H), 5.56 (dd, <i>J</i> = 7.2 Hz, 5.1 Hz, 1H), 7.23-7.32 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.35 (s, 1H), 10.44 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-058		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.53 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64-1.79 (m, 6H), 1.85-1.98 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.08 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 10.40 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 1 2 0



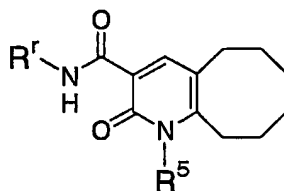
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-059		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.52 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.79 (m, 6H), 1.84-1.98 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.08 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 10.40 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-060		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 4H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.59-1.80 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (s, 3H), 3.28-3.43 (m, 2H), 3.97-4.09 (m, 2H), 5.58 (td, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1.5 Hz, 1H), 5.90 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 4.5 Hz, 1H), 7.18-7.35 (m, 4H), 8.35 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-061		nBu	0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 4H), 1.42 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.81 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (s, 3H), 3.28-3.44 (m, 2H), 3.92-4.09 (m, 2H), 5.58 (td, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1.5 Hz, 1H), 5.90 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 4.5 Hz, 1H), 7.20-7.35 (m, 4H), 8.35 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-062		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.54 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95, 3.34 (ABx, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.98-4.10 (m, 2H), 4.23 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.65 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.19-7.32 (m, 4H), 8.39 (s, 1H), 10.36 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-063		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.54 (m, 6H), 1.61-1.81 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95, 3.34 (ABx, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.98-4.10 (m, 2H), 4.23 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.65 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.19-7.32 (m, 4H), 8.39 (s, 1H), 10.36 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-064		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 1.99 (br s, 1H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.45, 3.58 (ABx, <i>J</i> = 5.4 Hz, 4.2 Hz, 2H), 4.02-4.21 (m, 2H), 4.33-4.41 (m, 1H), 5.03 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.42-7.46 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.62 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 1 2 1



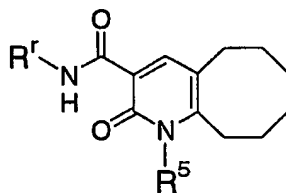
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-065		Bu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.53 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31, 3.57 (ABx, <i>J</i> = 5.4 Hz, 4.2 Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.76-4.85 (m, 1H), 5.36 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.26-7.35 (m, 3H), 7.45-7.49 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 10.53 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-066		Bu	0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H × 2), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.79 (m, 16H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.05 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.76 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-067		Bu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.34-1.51 (m, 6H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31, (s, 3H), 3.79-3.90 (m, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.87-5.94 (m, 1H), 7.45-7.62 (m, 3H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.80 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-068		Me-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	1.35 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.48 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.58 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.61-1.75 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.70 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.26-4.42 (m, 2H), 5.31 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.22-7.44 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-069		Me-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0.98-1.54 (m, 8H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.61-1.85 (m, 11H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00-4.14 (m, 1H), 4.25-4.43 (m, 2H), 8.33 (s, 1H), 9.81 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
10-070		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34-1.53 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.83 (s, 3H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.22, 3.50 (ABx, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 3.32 (s, 3H), 4.02-4.21 (m, 2H), 4.68-4.78 (m, 1H), 5.86 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.32-7.49 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.50 (d, <i>J</i> = 9.6 Hz, 1H).

表 1 2 2



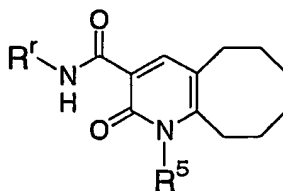
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-071		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33-1.50 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.60 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.38, 3.68 (ABx, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 4.01-4.19 (m, 2H), 4.60-4.69 (m, 1H), 5.01 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.20 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-072		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35-1.52 (m, 6H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.77, 3.87 (ABx, <i>J</i> = 6.6 Hz, 4.8 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.25 (quint, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 5.07 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.36 (m, 3H), 7.44-7.48 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.70 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H).
10-073		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.77, 3.87 (ABx, <i>J</i> = 6.6 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.08-4.16 (m, 2H), 4.25 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 5.07 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.23-7.36 (m, 3H), 7.44-7.49 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.70 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
10-074		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.32-1.54 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.78 (m, 6H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03-4.22 (m, 2H), 4.12, 5.32 (ABx, <i>J</i> = 12.0 Hz, 1.5 Hz, 2H), 4.60 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1.5 Hz, 1H), 6.32 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.38-7.42 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 10.97 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
10-075		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.35-1.56 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.79 (m, 6H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02-4.23 (m, 2H), 4.12, 5.32 (ABx, <i>J</i> = 9.9 Hz, 1.5 Hz, 2H), 4.56-4.63 (m, 1H), 6.32 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.38-7.42 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 10.97 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).

表 1 2 3



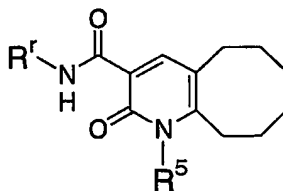
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-076		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.55, 3.77 (ABx, <i>J</i> = 6.0 Hz, 5.1 Hz, 2H), 3.73 (br s, 1H), 4.03-4.19 (m, 2H), 4.43-4.52 (m, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.46-7.50 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.67 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-077		nBu	0.05 (s, 3H), 0.06 (s, 3H), 0.93 (s, 9H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.51 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 1.90 (br s, 1H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.73, 3.82 (ABx, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.01-4.19 (m, 2H), 4.26 (sextet, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.24-7.33 (m, 3H), 7.43-7.48 (m, 2H), 8.22 (s, 1H), 10.71 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-078		nBu	0.05 (s, 3H), 0.06 (s, 3H), 0.93 (s, 9H), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.33-1.50 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.05 (br s, 1H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.73, 3.82 (ABx, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.02-4.20 (m, 2H), 4.27 (sextet, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 7.22-7.34 (m, 3H), 7.44-7.47 (m, 2H), 8.22 (s, 1H), 10.72 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-079		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.03 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06, 3.40 (ABx, <i>J</i> = 9.0 Hz, 7.2 Hz, 2H), 3.74 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 3.99-4.21 (m, 2H), 5.46 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.22-7.29 (m, 3H), 7.33-7.38 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 10.60 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
10-080		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.54 (m, 6H), 1.61-1.78 (m, 6H), 2.01 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11, 3.41 (ABx, <i>J</i> = 9.0 Hz, 7.5 Hz, 2H), 3.76 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 3.99-4.23 (m, 2H), 5.48 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.21-7.30 (m, 3H), 7.34-7.38 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H).

表 1 2 4



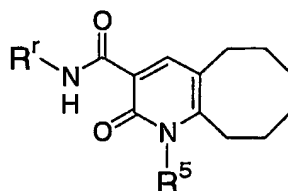
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-081		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.57 (m, 6H), 1.62-1.81 (m, 6H), 2.02 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71, 3.68 (ABx, <i>J</i> = 15.6 Hz, 7.8 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.07 (m, 1H), 4.11-4.27 (m, 2H), 5.60 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.21-7.35 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.66 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-082		nBu	0.97 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.58 (m, 6H), 1.66-1.82 (m, 6H), 2.02 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.71, 3.68 (ABx, <i>J</i> = 15.6 Hz, 7.8 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.06 (m, 1H), 4.12-4.28 (m, 2H), 5.60 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.20-7.34 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.66 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-083		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.17 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 6H), 1.37-1.56 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.43 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.70, 3.71 (ABx, <i>J</i> = 15.6 Hz, 7.8 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.98-4.06 (m, 1H), 4.13-4.21 (m, 2H), 5.60 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.22-7.37 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.65 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-084		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.94, 4.14 (ABx, <i>J</i> = 12.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 5.76-5.82 (m, 1H), 7.47-7.53 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 1H), 8.08-8.11 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 11.13 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
10-085		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.56 (m, 6H), 1.61-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.94, 4.14 (ABx, <i>J</i> = 12.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 5.77-5.83 (m, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.57-7.65 (m, 1H), 8.08-8.12 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 11.14 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).
10-086		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.53 (m, 6H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.89, 4.11 (ABx, <i>J</i> = 11.4 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 6.01-6.08 (m, 1H), 7.45-7.53 (m, 2H), 7.57-7.63 (m, 1H), 8.04-8.08 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.92 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 1 2 5



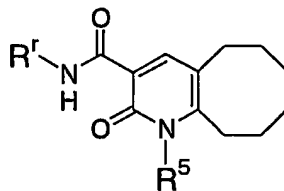
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-087		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.51 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90, 4.11 (ABx, <i>J</i> = 11.4 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 6.00-6.08 (m, 1H), 7.45-7.53 (m, 2H), 7.56-7.63 (m, 1H), 8.03-8.07 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.92 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-088		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 6H), 1.64-1.80 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.58 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.42-7.49 (m, 2H), 7.53-7.59 (m, 1H), 7.77-7.82 (m, 2H), 8.31 (s, 1H), 12.52 (br s, 1H).
10-089		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.55 (m, 6H), 1.60-1.81 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.51-5.58 (m, 1H), 7.27-7.48 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.77 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-090		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H × 2/5), 0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H × 3/5), 1.36-1.79 (m, 12H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 2/5), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 3/5), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 2/5), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H × 3/5), 3.52, 4.15 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 4.2 Hz, 2H), 4.10-4.20 (m, 2H), 4.83-4.91 (m, 1H × 3/5), 4.98-5.08 (m, 1H × 2/5), 5.30 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H × 2/5), 5.44 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H × 3/5), 7.28-7.38 (m, 3H), 7.46-7.53 (m, 2H), 8.16 (s, 1H × 2/5), 8.23 (s, 1H × 3/5), 10.46 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H × 2/5), 10.72 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H × 3/5).
10-091		nBu	-0.12 (s, 3H), -0.11 (s, 3H), 0.74 (s, 9H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.96-4.10 (m, 2H), 4.11-4.22 (m, 2H), 5.80-5.88 (m, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.53-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.81 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 1 2 6



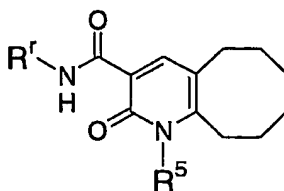
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-092		nBu	-0.12 (s, 3H), -0.11 (s, 3H), 0.74 (s, 9H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.96-4.10 (m, 2H), 4.10-4.23 (m, 2H), 5.80-5.87 (m, 1H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.53-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.80 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-093		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.63-1.81 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.56, 3.77 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 4.44-4.53 (m, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.25-7.37 (m, 3H), 7.46-7.49 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.69 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-094		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.34-4.42 (m, 1H), 4.48-4.57 (m, 2H), 5.03 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.41-7.46 (m, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.62 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-095		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.34-4.42 (m, 1H), 4.48-4.57 (m, 2H), 5.03 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 7.26-7.37 (m, 3H), 7.41-7.46 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 10.60 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-096		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 6H), 1.64-1.78 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.93 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.14-7.21 (m, 2H), 8.04-8.10 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-097		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.50 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 6H), 2.59 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.76, 4.15 (ABx, <i>J</i> = 11.7 Hz, 4.5 Hz, 2H), 4.00-4.13 (m, 2H), 4.98-5.07 (m, 1H), 5.30 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.24-7.37 (m, 3H), 7.49-7.53 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 10.46 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).

表 1 2 7



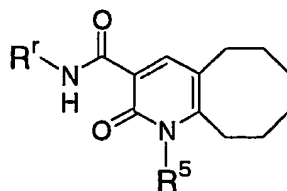
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-098		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.81 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.47, 3.65 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 4.83-4.92 (m, 1H), 6.28 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.29-7.39 (m, 3H), 7.44-7.53 (m, 2H), 8.17 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
10-099		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.62-1.79 (m, 6H), 2.59 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.86 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.76, 4.15 (ABx, <i>J</i> = 11.4 Hz, 4.5 Hz, 2H), 3.99-4.13 (m, 2H), 4.98-5.07 (m, 1H), 5.30 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.24-7.41 (m, 3H), 7.50-7.53 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 10.46 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-100		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.53 (m, 6H), 1.64-1.80 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.47, 3.65 (ABx, <i>J</i> = 11.1 Hz, 5.1 Hz, 2H), 4.08-4.18 (m, 2H), 4.83-4.92 (m, 1H), 6.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 7.30-7.38 (m, 3H), 7.45-7.49 (m, 2H), 8.17 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 10.64 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H).
10-101			1.21-1.52 (m, 8H), 1.59-1.79 (m, 8H), 1.94-1.99 (m, 2H), 2.09 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.78 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.93-4.03 (m, 1H), 4.05 (dd, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2.1 Hz, 1H), 4.20 (dd, <i>J</i> = 14.1 Hz, 2.1 Hz, 1H), 4.25 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.49 (dd, <i>J</i> = 14.4 Hz, 6.9 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.85 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-102			1.30-1.54 (m, 8H), 1.60-1.78 (m, 8H), 1.87-2.00 (m, 4H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.53 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91-4.02 (m, 1H), 4.34 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.37 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-103		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.55 (m, 4H), 1.49 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.68-1.83 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.21 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.55 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 12.41 (br s, 1H).

表 1 2 8



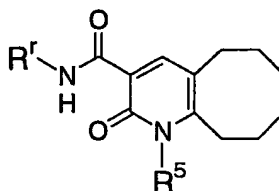
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-104		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.91 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 6.97 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.03 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.80 (br s, 1H).
10-105		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.91 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-106		Me-O-CH ₂ -CH ₃	1.30-1.53 (m, 8H), 1.58-1.79 (m, 8H), 1.96-2.02 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.03 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.69 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.33 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.83 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-107		Me-O-CH ₂ -CH ₃	1.35-1.42 (m, 2H), 1.43-1.52 (m, 2H), 1.62-1.79 (m, 4H), 2.70 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.40 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.05 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.75 (br s, 1H).
10-108		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 6H), 1.63-1.79 (m, 8H), 1.95-2.07 (m, 2H), 2.20-2.33 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82-2.94 (m, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.55 (br s, 2H), 3.96-4.07 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.23-7.40 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 9.97 (br s, 1H).
10-109		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 6H), 1.63-1.79 (m, 6H), 1.81-1.97 (m, 2H), 2.04 (s, 3H), 2.15-2.24 (m, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.01 (t, <i>J</i> = 10.2 Hz, 2H), 3.33-3.41 (m, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.10-4.25 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 10.21 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 1 2 9



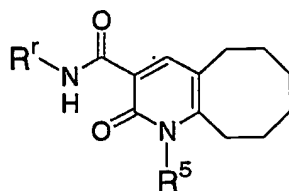
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-110		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.58 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.97-2.11 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92-3.02 (m, 1H), 3.21-3.31 (m, 1H), 3.75-3.81 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.11-4.23 (m, 1H), 4.37-4.43 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 10.08 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-111		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36-1.57 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.93-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11-3.27 (m, 2H), 3.69-3.79 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.19-4.30 (m, 1H), 4.50-4.60 (m, 1H), 7.41 (s, 5H), 8.29 (s, 1H), 10.12 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-112		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.29 (s, 9H), 1.35-1.79 (m, 14H), 2.00-2.09 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.09 (t, <i>J</i> = 11.4 Hz, 2H), 4.06-4.35 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.06 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-113		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28-1.81 (m, 24H), 1.98-2.10 (m, 2H), 2.44-2.53 (m, 1H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89-2.99 (m, 1H), 3.15-3.28 (m, 1H), 3.85-3.93 (m, 1H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.10-4.25 (m, 1H), 4.40-4.48 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 10.06 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-114		nBu	1.02 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.78 (m, 14H), 2.07-2.20 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94-3.01 (m, 2H), 3.70-3.79 (m, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.11-4.23 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 10.11 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-115		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.51 (m, 6H), 1.62-1.78 (m, 8H), 2.03-2.09 (m, 2H), 2.53 (td, <i>J</i> = 11.4 Hz, 2.4 Hz, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.71-3.77 (m, 2H), 3.82-3.94 (m, 1H), 4.07 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.52-7.65 (m, 3H), 7.76-7.71 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.00 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).

表 1 3 0



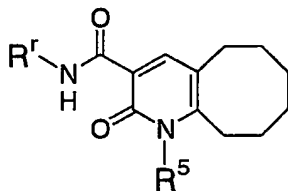
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-116		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 4H), 1.47 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.64-1.82 (m, 8H), 2.01-2.09 (m, 2H), 2.25-2.34 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.82-2.90 (m, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.97-4.06 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.28 (s, 1H), 9.98 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-117			1.21-1.53 (m, 8H), 1.62-1.82 (m, 8H), 1.95-2.00 (m, 2H), 2.20 (dt, <i>J</i> = 15.0 Hz, 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.02 (m, 1H), 4.28 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 9.80 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-118			1.26-1.52 (m, 8H), 1.60-1.80 (m, 8H), 1.94-2.00 (m, 2H), 2.19 (quint, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.06 (s, 3H), 3.92-4.01 (m, 1H), 4.27 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.38 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 8.33 (s, 1H), 9.78 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-119			1.25-1.52 (m, 8H), 1.59-1.79 (m, 8H), 1.93-2.05 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 3.91-4.01 (m, 1H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.82 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-120			1.25-1.52 (m, 8H), 1.58-1.80 (m, 8H), 1.93-2.03 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.48 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.20 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.81 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-121			1.27-1.53 (m, 8H), 1.60-1.81 (m, 8H), 1.92-2.01 (m, 2H), 2.05 (s, 3H), 2.20-2.29 (m, 2H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98 (br s, 2H), 3.90-4.00 (m, 1H), 4.27-4.35 (m, 2H), 8.40 (s, 1H), 9.50 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-122			1.24-1.52 (m, 8H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.88-2.03 (m, 4H), 2.03 (s, 3H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.24-3.30 (m, 2H), 3.97-4.05 (m, 1H), 4.22 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.72 (br s, 1H), 8.35 (s, 1H), 9.81 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 1 3 1



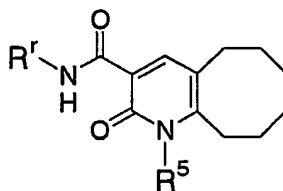
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-123		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.52 (m, 6H), 1.60-1.72 (m, 6H), 1.71-1.80 (m, 2H), 2.07-2.17 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.17 (t, <i>J</i> = 11.1 Hz, 1H), 3.37 (t, <i>J</i> = 11.1 Hz, 1H), 3.92-3.99 (m, 1H), 4.03-4.12 (m, 2H), 4.22-4.37 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-124		BzHN-	1.29-1.51 (m, 8H), 1.65-1.77 (m, 8H), 1.92-2.05 (m, 4H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.45 (br s, 2H), 3.97-4.05 (m, 1H), 4.32 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.42-7.55 (m, 3H), 7.89 (br s, 1H), 7.90-7.96 (m, 2H), 8.37 (s, 1H), 9.90 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-125			1.25 (s, 9H), 1.28-1.51 (m, 8H), 1.60-1.78 (m, 8H), 1.85-2.00 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.23 (br s, 2H), 3.95-4.04 (m, 1H), 4.22 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.12 (br s, 1H), 8.35 (s, 1H), 9.89 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-126			1.27-1.52 (m, 8H), 1.57-1.80 (m, 14H), 1.83-2.01 (m, 6H), 2.55-2.65 (m, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.25-3.29 (m, 2H), 3.95-4.04 (m, 1H), 4.22 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.73 (br s, 1H), 8.34 (s, 1H), 9.85 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-127			1.29-1.52 (m, 8H), 1.61-1.79 (m, 8H), 1.91-2.02 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.34 (br s, 2H), 3.97-4.04 (m, 1H), 4.27 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.39 (s, 1H), 8.67 (br s, 1H), 9.76 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-128		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.54 (m, 6H), 1.68-1.81 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 12.69 (br s, 1H).

表 1 3 2



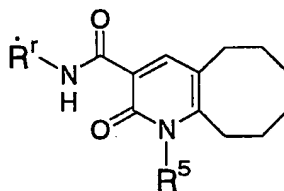
化合物 No.	R ¹	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-129		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.54 (m, 6H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 6.22 (s, 1H×1/5), 6.39 (s, 1H×1/5), 6.47 (s, 1H×1/5), 6.64 (s, 1H×1/5), 6.88 (s, 1H×1/5), 7.01-7.10 (m, 1H), 7.18-7.27 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 8.60 (dd, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1.8 Hz, 1H), 12.59 (br s, 1H).
10-130		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.53 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65-1.82 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.18 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.08 (td, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1.8 Hz, 1H), 7.26-7.34 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 8.64 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1.8 Hz, 1H), 12.76 (br s, 1H).
10-131		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.82 (m, 6H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.41 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 13.49 (br s, 1H).
10-132		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.52 (m, 4H), 1.48 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.85 (m, 6H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.27-7.32 (m, 1H), 7.36-7.42 (m, 2H), 7.57-7.61 (m, 2H), 7.71 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 13.52 (br s, 1H).
10-133		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.55 (m, 4H), 1.49 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65-1.81 (m, 6H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.19 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.38-7.52 (m, 4H), 7.78 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 8.33 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 12.61 (br s, 1H).
10-134		MsHN	1.28-1.52 (m, 8H), 1.63-1.80 (m, 8H), 1.92-2.01 (m, 4H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (s, 3H), 3.08 (q, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 3.94-4.02 (m, 1H), 4.29 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.84 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 9.72 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 1 3 3



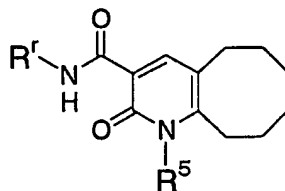
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-135			1.29-1.50 (m, 8H), 1.63-1.78 (m, 8H), 1.86-2.00 (m, 4H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.79-2.90 (m, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.95-4.03 (m, 1H), 4.24 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.19 (br s, 1H), 7.44-7.58 (m, 3H), 7.82-7.87 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 9.75 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-136		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.53 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.64-1.77 (m, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.21, 3.66 (ABx, <i>J</i> = 13.8 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.92-6.00 (m, 1H), 7.46-7.52 (m, 2H), 7.55-7.62 (m, 1H), 8.12-8.16 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.76 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-137		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.52 (m, 4H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.63-1.77 (m, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.21, 3.66 (ABx, <i>J</i> = 13.8 Hz, 6.0 Hz, 2H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.92-6.00 (m, 1H), 7.46-7.62 (m, 3H), 8.12-8.16 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 10.75 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-138			1.01 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 6H), 1.38-1.52 (m, 4H), 1.60-1.73 (m, 5H), 1.78 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-139			1.05-1.38 (m, 6H), 1.50 (br s, 2H), 1.63-1.77 (m, 10H), 1.82-1.93 (m, 1H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (br s, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.31 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
10-140			1.31-1.51 (m, 10H), 1.57-1.79 (m, 14H), 1.94-2.01 (m, 2H), 2.50-2.66 (m, 8H), 3.90-4.01 (m, 1H), 4.28 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.30 (s, 1H), 9.84 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 1 3 4



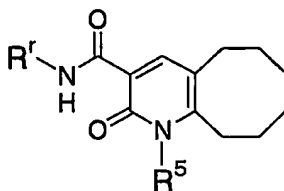
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-141			1.01 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6H), 1.34-1.53 (m, 4H), 1.56-1.80 (m, 9H), 1.97-2.05 (m, 2H), 2.17-2.27 (m, 2H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81-2.89 (m, 2H), 2.87 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.54 (s, 2H), 3.96-4.04 (m, 1H), 4.11 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.26-7.35 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 9.96 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-142			1.05-1.36 (m, 8H), 1.48 (br s, 2H), 1.64-1.88 (m, 11H), 1.96-2.05 (m, 2H), 2.22 (t, <i>J</i> = 9.9 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81-2.86 (m, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.54 (s, 2H), 3.93-4.02 (m, 3H), 7.23-7.36 (m, 5H), 8.29 (s, 1H), 9.96 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-143			1.02 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H), 1.36-1.73 (m, 8H), 1.77 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4H), 1.98-2.10 (m, 1H), 2.05 (s, 3H), 2.21-2.30 (m, 2H), 2.61-2.68 (m, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.09 (t, <i>J</i> = 9.9 Hz, 2H), 3.42-3.50 (m, 2H), 4.05-4.21 (m, 3H), 8.25 (s, 1H), 10.27 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
10-144			1.01 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H), 1.36-1.72 (m, 9H), 1.76 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 4H), 1.99-2.10 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91-3.00 (m, 1H), 3.21-3.03 (m, 1H), 3.76-3.81 (m, 1H), 4.10 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.11-4.25 (m, 1H), 4.36-4.44 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 10.07 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-145			1.01 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6H), 1.37-1.80 (m, 13H), 2.08-2.16 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89-2.99 (m, 2H), 3.68-3.76 (m, 2H), 4.05-4.16 (m, 3H), 8.27 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-146			1.01 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 6H), 1.38-1.78 (m, 13H), 2.08-2.15 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11-3.21 (m, 1H), 3.31-3.41 (m, 1H), 3.96 (t, <i>J</i> = 14.4 Hz, 1H), 4.14 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.21-4.38 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.16 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 135



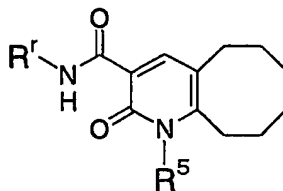
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-147			1.06-1.40 (m, 8H), 1.49 (br s, 2H), 1.61-1.99 (m, 11H), 2.18-2.28 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (t, <i>J</i> = 10.5 Hz, 2H), 3.38-3.44 (m, 2H), 4.05-4.20 (m, 3H), 8.26 (s, 1H), 10.23 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-148			1.02-1.33 (m, 8H), 1.45-1.80 (m, 13H), 1.98-2.10 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93-3.01 (m, 1H), 3.21-3.31 (m, 1H), 3.74-3.81 (m, 1H), 3.99 (br s, 1H), 4.10-4.23 (m, 2H), 4.37-4.43 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 10.08 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
10-149			1.02-1.33 (m, 8H), 1.49 (br s, 2H), 1.60-1.81 (m, 11H), 2.08-2.15 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.90-3.00 (m, 4H), 3.69-3.76 (m, 2H), 3.99 (br s, 1H), 4.06-4.12 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
10-150			1.03-1.38 (m, 8H), 1.49 (br s, 2H), 1.60-1.85 (m, 11H), 2.07-2.17 (m, 2H), 2.65 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.11-3.21 (m, 1H), 3.31-3.41 (m, 1H), 3.96 (d, <i>J</i> = 14.4 Hz, 2H), 4.00 (br s, 1H), 4.22-4.38 (m, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-151		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.37-1.54 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.66-1.83 (m, 6H), 2.49 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 6.87 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.59 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.15 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 12.55 (br s, 1H).
10-152		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.54 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.66-1.83 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 6.99-7.04 (m, 1H), 7.67-7.74 (m, 1H), 8.33-8.37 (m, 2H), 8.36 (s, 1H), 12.77 (br s, 1H).
10-153		Me-O-CH ₂ -CH ₃	1.36-1.43 (m, 2H), 1.47-1.55 (m, 2H), 1.65-1.80 (m, 4H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.08 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (t, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 4.39 (t, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 7.18 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 0.9 Hz, 1H), 7.54 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.33 (dd, <i>J</i> = 8.1 Hz, 0.9 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 12.62 (br s, 1H).

表 1 3 6



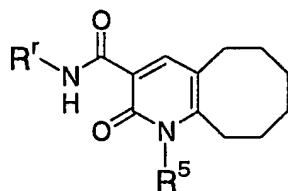
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-154			1.38-1.83 (m, 14H), 2.52-2.73 (m, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.02 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.39 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.19 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.54 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.33 (dd, <i>J</i> = 8.4 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 12.58 (br s, 1H).
10-155			1.37-1.55 (m, 4H), 1.67-1.86 (m, 4H), 1.97 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.97 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.60 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.39 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.20 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.54 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.33 (dd, <i>J</i> = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 12.45 (br s, 1H).
10-156			1.39-1.46 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 1.77-1.85 (m, 2H), 2.23 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.10 (s, 3H), 4.33 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.40 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.19 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.55 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (dd, <i>J</i> = 8.4 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 12.56 (br s, 1H).
10-157			1.37-1.45 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 1.76-1.85 (m, 2H), 2.03 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.21 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 12.59 (br s, 1H).
10-158			1.38-1.45 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.66-1.74 (m, 2H), 1.77-1.86 (m, 2H), 1.97-2.07 (m, 2H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.95 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.52 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.25 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.19 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.54 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (dd, <i>J</i> = 8.4 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 12.58 (br s, 1H).

表 1 3 7



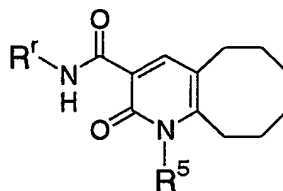
化合物 No.	R ¹	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-159		AcHN	1.38-1.44 (m, 2H), 1.47-1.56 (m, 2H), 1.65-1.74 (m, 2H), 1.76-1.84 (m, 2H), 1.94 (quint, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.30 (q, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.26 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.63 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.21 (dd, <i>J</i> = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.56 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.34 (dd, <i>J</i> = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 12.51 (br s, 1H).
10-160		MsHN	1.41-1.85 (m, 8H), 2.01-2.11 (m, 2H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.04 (s, 3H), 3.18 (q, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.34 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.58 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.20 (dd, <i>J</i> = 7.5 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.55 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.31 (dd, <i>J</i> = 8.1 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 12.45 (br s, 1H).
10-161		F ₃ C	1.42-1.83 (m, 8H), 2.03 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.69 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.41 (q, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.30 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.22 (dd, <i>J</i> = 7.8 Hz, 0.6 Hz, 1H), 7.56 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.13 (br s, 1H), 8.31 (dd, <i>J</i> = 7.8 Hz, 0.6 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 12.40 (br s, 1H).
10-162		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39-1.57 (m, 4H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.65-1.83 (m, 6H), 2.51 (s, 3H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.92 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 1H), 12.91 (br s, 1H).
10-163		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.53 (m, 4H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.65-1.82 (m, 6H), 2.47 (s, 6H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.15 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 6.74 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 12.75 (br s, 1H).
10-164		OHC	1.22-1.52 (m, 8H), 1.63-1.79 (m, 8H), 1.92-2.00 (m, 2H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 3.92-4.03 (m, 1H), 4.42 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.75 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 9.84 (s, 1H).

表 1 3 8



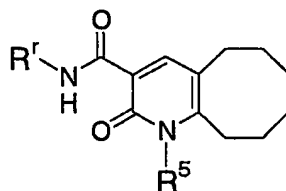
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-165			1.20 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.21-1.87 (m, 18H), 1.90-2.01 (m, 2H), 2.55-2.73 (m, 2H), 2.85-3.02 (m, 2H), 3.62-3.70 (m, 1H), 3.92-4.01 (m, 2H), 4.65-4.78 (m, 1H), 8.36 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-166			1.23-1.51 (m, 8H), 1.58-1.78 (m, 8H), 1.94-2.00 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.92-4.01 (m, 1H), 4.36 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.31 (s, 1H), 9.78 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-167			1.38-1.43 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.65-1.83 (m, 4H), 1.86-1.95 (m, 2H), 1.91-2.05 (m, 1H), 2.63-2.74 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.85-2.96 (m, 1H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.51 (br t, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 4.22-4.38 (m, 2H), 5.66 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.19-7.38 (m, 4H), 8.43 (s, 1H), 10.11 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-168			1.38-1.42 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.64-1.80 (m, 4H), 1.91-2.08 (m, 1H), 2.11-2.21 (m, 2H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.83-2.96 (m, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.06 (m, 1H), 3.02 (s, 3H), 4.25 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.33 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.16-7.26 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 10.13 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-169			1.37-1.43 (m, 2H), 1.44-1.53 (m, 2H), 1.67-1.80 (m, 4H), 1.91-2.10 (m, 1H), 2.00-2.20 (m, 2H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.96 (m, 1H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.98-3.08 (m, 1H), 4.25 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.45 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.61 (t, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.16-7.28 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 10.17 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H).

表 1 3 9



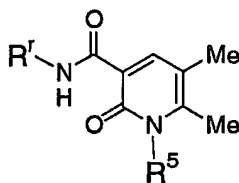
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-170			1.38-1.43 (m, 2H), 1.44-1.54 (m, 2H), 1.67-1.82 (m, 4H), 1.91-2.06 (m, 1H), 2.06 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.49 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 2.62-2.74 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.85-2.96 (m, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 4.21 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.19-7.26 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.40 (s, 1H), 10.08 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-171			1.37-1.44 (m, 2H), 1.45-1.55 (m, 2H), 1.67-1.80 (m, 4H), 1.93-2.03 (m, 3H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84-2.96 (m, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.99-3.09 (m, 1H), 3.50 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.17 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.18-7.26 (m, 3H), 7.35-7.39 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 10.16 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H).
10-172			1.37-1.43 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.83-2.02 (m, 1H), 1.87 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 1.95 (s, 3H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.69-2.76 (m, 1H), 2.88-2.95 (m, 1H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.97-3.08 (m, 1H), 3.23 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.19 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 6.65 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.28 (m, 3H), 7.36-7.39 (m, 1H), 8.41 (s, 1H), 10.15 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-173			1.37-1.42 (m, 2H), 1.44-1.53 (m, 2H), 1.63-1.78 (m, 4H), 1.90-2.02 (m, 3H), 2.62-2.73 (m, 1H), 2.67 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.84 (s, 3H), 2.85-2.97 (m, 1H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.00-3.10 (m, 2H), 4.25 (br s, 2H), 5.67 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.19-7.36 (m, 4H), 8.42 (s, 1H), 10.06 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
10-174			1.38-1.43 (m, 2H), 1.44-1.52 (m, 2H), 1.65-1.80 (m, 4H), 1.88-2.00 (m, 3H), 2.68 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.69-2.76 (m, 1H), 2.88-2.98 (m, 1H), 2.91 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.00-3.10 (m, 1H), 3.25-3.37 (m, 2H), 4.24 (br s, 2H), 5.61 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.39 (m, 4H), 8.42 (br s, 1H), 8.44 (s, 1H), 10.05 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 1 4 0



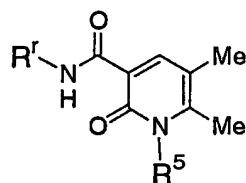
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
10-175		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.02-1.28 (m, 6H), 1.36-1.52 (m, 8H), 1.62-1.80 (m, 8H), 1.92 (br d, <i>J</i> = 12.0 Hz, 1H), 2.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.45-3.62 (m, 3H), 4.07-4.15 (m, 2H), 8.30 (s, 1H), 10.28 (br s, 1H).
10-176		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.20-1.51 (m, 14H), 1.58-1.91 (m, 8H), 2.41-2.50 (m, 1H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.36 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 8.26 (s, 1H), 10.50 (br s, 1H).
10-177		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.37-1.53 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.61-1.81 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.39-4.48 (m, 1H), 4.98 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.23-7.39 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
10-178		nBu	0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.37-1.53 (m, 4H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.62-1.80 (m, 6H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.90 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.09 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.39-4.49 (m, 1H), 4.98 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 7.23-7.40 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.10 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-179		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 4H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.63-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.88 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.69-5.79 (m, 1H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.55-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.73 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
10-180		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.37-1.50 (m, 4H), 1.43 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.65-1.80 (m, 6H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.89 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.12 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.69-5.79 (m, 1H), 7.45-7.51 (m, 2H), 7.55-7.61 (m, 1H), 8.05-8.09 (m, 2H), 8.28 (s, 1H), 10.73 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).

表 1 4 1



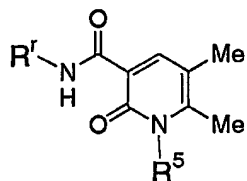
化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
11-001		nBu	1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.65-1.79 (m, 2H), 1.79 (s, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.16-7.22 (m, 2H), 7.26-7.33 (m, 2H), 7.42-7.46 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 10.40 (br s, 1H).
11-002		Bn	1.79 (s, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 5.50 (br s, 2H), 7.09-7.47 (m, 10H), 8.35 (s, 1H), 10.35 (br s, 1H).
11-003			1.05-1.32 (m, 4H), 1.58-1.91 (m, 7H), 1.79 (s, 6H), 2.12 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.01 (br s, 2H), 7.16-7.21 (m, 1H), 7.26-7.32 (m, 2H), 7.43-7.46 (m, 2H), 8.24 (s, 1H), 10.39 (br s, 1H).
11-004			1.00-1.30 (m, 4H), 1.55-1.90 (m, 7H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.89-4.00 (m, 2H), 4.03 (br s, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.72 (br d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
11-005			1.00-1.30 (m, 4H), 1.60-1.92 (m, 7H), 2.17 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.90 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (br s, 2H), 5.50-5.56 (m, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.73 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
11-006			1.00-1.30 (m, 4H), 1.56-1.88 (m, 7H), 1.90-2.00 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.71 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 3.46 (quint, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.03 (br s, 2H), 7.14-7.30 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 9.98 (br s, 1H).
11-007		nBu	0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.51 (m, 2H), 1.62-1.73 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 3.89-4.00 (m, 2H), 4.12 (dd, <i>J</i> = 9.0 Hz, <i>J</i> = 5.1 Hz, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.72 (br d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
11-008		nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.41-1.53 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 3.91 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.13 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 5.50-5.57 (m, 1H), 7.28-7.45 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.73 (br d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
11-009			0.84 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H), 1.06-1.85 (m, 21H), 2.17 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.00 (br s, 2H), 4.09-4.18 (m, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).

表 1 4 2



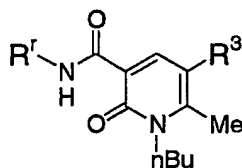
化合物 No.	R ^r	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
11-010			0.60-0.65 (m, 2H), 0.77-0.84 (m, 2H), 1.05-1.26 (m, 5H), 1.59-1.85 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.89-2.98 (m, 1H), 4.00 (br s, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.89 (br s, 1H).
11-011			0.86-2.19 (m, 15H), 2.19 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.72-2.91 (m, 2H), 3.94 (br s, 2H), 5.37-5.44 (m, 1H), 7.06-7.16 (m, 3H), 7.34-7.37 (m, 1H), 8.38 (s, 1H), 10.22 (br d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
11-012			0.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.06-1.85 (m, 14H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.20-3.29 (m, 1H), 3.34-3.42 (m, 1H), 4.03 (br s, 2H), 8.32 (s, 1H), 9.95 (br s, 1H).
11-013			0.98 (s, 9H), 1.07-1.23 (m, 5H), 1.62-1.83 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.26 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.03 (br s, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.06 (br s, 1H).
11-014			1.05-1.23 (m, 5H), 1.62-1.87 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.00 (br s, 2H), 4.62 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 2H), 6.25-6.31 (m, 2H), 7.35 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 10.23 (br s, 1H).
11-015			0.88 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.16-1.30 (m, 1H), 1.35-1.48 (m, 1H), 1.89-2.00 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.03 (br s, 1H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
11-016			0.90 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.17-1.32 (m, 1H), 1.35-1.49 (m, 1H), 1.88-2.00 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.06 (br s, 2H), 7.17-7.31 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
11-017			0.98 (s, 9H), 2.18 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 4.34 (br s, 2H), 7.20-7.37 (m, 5H), 8.34 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
11-018			0.99 (s, 9H), 2.17 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.91 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 7.16-7.31 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.01 (br s, 1H).
11-019			2.19 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.63 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 5.34 (s, 2H), 6.33 (m, 2H), 7.21-7.37 (m, 6H), 8.38 (s, 1H), 10.18 (br s, 1H).

表 1 4 3



化合物 No.	R ^f	R ⁵	¹ H-NMR (CDCl ₃)
11-020			2.19 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 2.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 5.34 (s, 2H), 6.35 (m, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 7.35 (t, <i>J</i> = 1.5 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 9.92 (br s, 1H).
11-021			0.45-0.66 (m, 4H), 1.08-1.18 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 4.11 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.36 (s, 1H), 10.31 (br s, 1H).
11-022			0.47-0.61 (m, 4H), 1.09-1.17 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.63-6.70 (m, 2H), 4.12 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.33 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
11-023	H	nBu	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.53 (m, 2H), 1.63-1.73 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.13 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 5.73 (br s, 1H), 8.31 (s, 1H), 9.62 (br s, 1H).
11-024			1.05-1.26 (m, 6H), 1.66-1.77 (m, 4H), 1.83-1.92 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 4.08 (br s, 2H), 4.97 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.02-8.06 (m, 2H), 8.32 (s, 1H), 10.78 (br s, 1H).
11-025		Bn	2.19 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.98 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 5.52 (br s, 2H), 7.14 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.29-7.36 (m, 3H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.41 (s, 1H), 10.74 (br s, 1H).

表 1 4 4



化合物 No.	R ¹	R ³	¹ H-NMR (CDCl ₃)
12-001			1.04 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.42-1.54 (m, 2H), 1.67-1.78 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 4.12-4.18 (m, 8H), 8.29 (s, 1H), 9.91 (t, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H).
12-002			1.04 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.43-1.55 (m, 2H), 1.70-1.80 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.97 (m, 2H), 3.67-3.74 (m, 2H), 4.18 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 3H), 6.55 (m, 1H), 6.90-6.94 (m, 1H), 7.19-7.46 (m, 8H), 8.50 (s, 1H), 8.79 (brs, 1H), 10.14 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H).
12-003		Et	0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.16 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.51 (m, 2H), 1.60-1.72 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.53 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.09 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.38 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
12-004		Et	1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.16 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.61-1.73 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.52 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.94 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.11 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.04 (br s, 1H).

表 1 4 5

化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
13-001		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.19 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.53-1.72 (m, 4H), 2.50 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.62-2.68 (m, 2H), 4.06 (m, 2H), 4.64 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.23-7.37 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.32 (br s, 1H).
13-002		1.01 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.09 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.19 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.54-1.73 (m, 4H), 2.50 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.62-2.68 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.37 (s, 1H), 10.06 (br s, 1H).
13-003		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.53-1.72 (m, 4H), 2.19 (s, 3H), 2.62-2.68 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
13-004		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.53-1.72 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 2.62-2.68 (m, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 2H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
13-005		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.53 (m, 6H), 1.62-1.72 (m, 6H), 2.54 (s, 3H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.4 Hz, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.21-7.38 (m, 2H), 7.55 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.79 (br s, 1H).
13-006		0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.53 (m, 6H), 1.62-1.75 (m, 6H), 2.62 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 2.83 (t, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 4.10 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 7.32-7.47 (m, 3H), 7.72-7.75 (m, 1H), 8.39 (s, 1H), 9.18 (br s, 1H).
13-007		0.97 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.34-1.46 (m, 2H), 1.72-1.82 (m, 2H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 5.21 (s, 2H), 7.06 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 7.23-7.40 (m, 8H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (br s, 1H).
13-008		0.96 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.36-1.56 (m, 6H), 1.58-1.71 (m, 4H), 1.71-1.81 (m, 2H), 2.57 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.85 (t, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.08-3.20 (m, 2H), 3.18 (t, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 3.92 (t, <i>J</i> = 5.0 Hz, 2H), 4.06 (tlike, 2H), 6.87-7.00 (m, 5H).
13-009		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.22 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.36-1.51 (m, 2H), 1.61-1.72 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.73 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.20-7.39 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).

表 1 4 6

化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
13-010		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.23 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.52 (m, 2H), 1.61-1.73 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.73 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.63-3.70 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.17-7.32 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.03 (br s, 1H).
13-011		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.61-1.77 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 6.28 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.20-7.40 (m, 5H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 10.21 (br s, 1H).
13-012		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.06 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.55 (m, 2H), 1.61-1.77 (m, 4H), 2.66 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.62-3.70 (m, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.27 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.32 (m, 5H), 8.41 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 9.95 (br s, 1H).
13-013		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 4.08 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 7.32-7.54 (m, 8H), 7.76-7.79 (m, 1H), 8.92 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 9.29 (s, 1H).
13-014		0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.60 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz), 1.77-1.87 (m, 2H), 4.09 (dt, <i>J</i> = 7.1, 3.7 Hz, 2H), 5.32 (dt, <i>J</i> = 7.3, 7.0 Hz, 1H), 7.21-7.48 (m, 5H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.83 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz).
13-015		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.18-7.59 (m, 4H), 8.70 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.84 (br s, 1H).
13-016		0.98 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.46 (m, 2H), 1.57 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.70-1.80 (m, 2H), 3.97 (dt, <i>J</i> = 4.3, 7.0 Hz, 2H), 5.29 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 7.21-7.40 (m, 5H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.62 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 10.08 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H).
13-017		0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37-1.49 (m, 2H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.77-1.87 (m, 2H), 4.00-4.15 (m, 2H), 5.31 (dt, <i>J</i> = 7.6, 7.3 Hz, 1H), 7.21-7.43 (m, 3H), 7.65 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.19 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H).
13-018		0.99 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.38-1.50 (m, 2H), 1.60 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz), 1.77-1.87 (m, 2H), 4.09 (dt, <i>J</i> = 7.1, 3.7 Hz, 2H), 5.32 (dt, <i>J</i> = 7.3, 7.0 Hz, 1H), 7.21-7.48 (m, 5H), 7.69 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 8.83 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 1H), 10.29 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz).

表 1 4 7

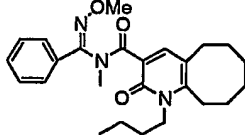
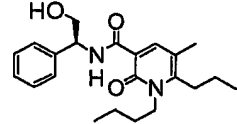
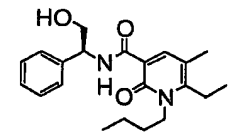
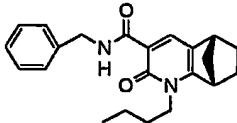
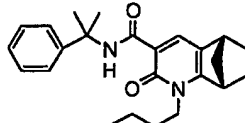
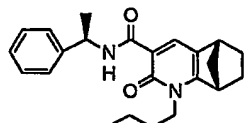
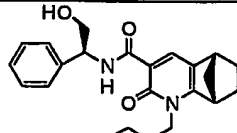
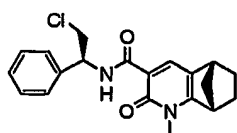
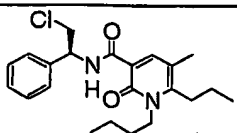
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
13-019		0.90 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.23-1.71 (m, 12H), 2.41 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (br t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.70-4.00 (m, 2H), 4.01 (s, 3H), 7.11-7.61 (m, 6H).
13-020		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.73 (m, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.63-2.69 (m, 2H), 3.89-3.99 (m, 2H), 4.08 (s, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.27-7.43 (m, 5H), 8.31 (s, 1H), 10.72 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H).
13-021		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.23 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.39-1.52 (m, 2H), 1.63-1.74 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.74 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 3.89-4.00 (m, 2H), 4.09 (s, 2H), 5.26-5.32 (m, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.32 (s, 1H), 10.72 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
13-022		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.19-1.26 (m, 2H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.52-1.62 (m, 1H), 1.72 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.81-1.87 (m, 1H), 1.92-2.07 (m, 2H), 3.40 (br s, 1H), 3.47 (br s, 1H), 3.89-3.99 (m, 1H), 4.17-4.26 (m, 1H), 4.57-4.71 (m, 2H), 7.20-7.38 (m, 5H), 8.44 (s, 1H), 10.30 (br s, 1H).
13-023		1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.18-1.30 (m, 4H), 1.43-1.60 (m, 2H), 1.64-1.81 (m, 2H), 1.78 (s, 6H), 1.89-2.05 (m, 2H), 3.33 (br s, 1H), 3.47 (br s, 1H), 3.92-4.01 (m, 1H), 4.21-4.31 (m, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 7.43-7.46 (m, 2H), 8.33 (s, 1H), 10.42 (br s, 1H).
13-024		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.17-1.26 (m, 2H), 1.39-1.60 (m, 4H), 1.55 (d, <i>J</i> = 3.0 Hz, 3H), 1.68-1.85 (m, 2H), 1.90-2.07 (m, 2H), 3.37 (br s, 1H), 3.47 (br s, 1H), 3.88-4.01 (m, 1H), 4.17-4.30 (m, 1H), 5.30 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 7.18-7.41 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.34 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
13-025		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.19-1.26 (m, 1H), 1.41-2.10 (m, 9H), 3.39 (br s, 1H), 3.49 (br s, 1H), 3.89-3.99 (m, 3H), 4.20-4.30 (m, 1H), 5.29 (q, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.26-7.43 (m, 5H), 8.40 (s, 1H), 10.71 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H).
13-026		1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.20-1.31 (m, 2H), 1.41-1.55 (m, 2H), 1.70-1.88 (m, 4H), 1.90-2.08 (m, 2H), 3.38 (br s, 1H), 3.48 (br s, 1H), 3.90 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 3.95-4.02 (m, 1H), 4.20-4.31 (m, 1H), 5.50-5.58 (m, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.39 (s, 1H), 10.74 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).
13-027		1.00 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.08 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.40-1.72 (m, 6H), 2.17 (s, 3H), 2.63-2.68 (m, 2H), 3.90 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 2H), 4.11 (br s, 2H), 5.54 (s, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.74 (br d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H).

表 1 4 8

化合物 No.	構造	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3)
13-028		1.00 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.23 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.41-1.53 (m, 2H), 1.65-1.78 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.74 (quint, $J = 7.8$ Hz, 2H), 3.90 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H), 4.11 (br s, 2H), 5.50-5.57 (m, 1H), 7.26-7.44 (m, 5H), 8.30 (s, 1H), 10.74 (br d, $J = 7.5$ Hz, 1H).
13-029		0.70 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.11 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.54 (quint, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.61 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.70-3.86 (m, 2H), 5.34 (quint, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.17-7.58 (m, 10H), 8.43 (s, 1H), 10.41 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H).
13-030		0.72 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.12 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.57 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.82 (s, 6H), 3.81 (t, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.16-7.57 (m, 10H), 8.37 (s, 1H), 10.49 (br s, 1H).
13-031		0.70 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.10 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.54 (quint, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.83 (s, 3H), 3.76-3.86 (m, 2H), 3.91-4.03 (m, 2H), 5.29-5.36 (m, 1H), 7.16-7.57 (m, 10H), 8.48 (s, 1H), 10.82 (d, $J = 6.6$ Hz, 1H).
13-032		0.70 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.01 (s, 9H), 1.11 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.54 (quint, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.83 (s, 3H), 3.29 (t, $J = 4.8$ Hz, 2H), 3.80 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 7.20-7.67 (m, 2H), 7.50-7.60 (m, 3H), 8.46 (s, 1H), 10.15 (br s, 1H).
13-033		0.71 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.11 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.56 (quint, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.82 (s, 3H), 3.81 (dd, $J = 6.0$ Hz, 3.6 Hz, 2H), 3.93 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 5.53-5.61 (m, 1H), 7.19-7.57 (m, 10H), 8.44 (s, 1H), 10.83 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H).
13-034		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.58 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.64-1.77 (m, 4H), 1.83-1.92 (m, 2H), 2.60 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.74 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.00-4.10 (m, 2H), 5.30 (quint, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.19-7.42 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.34 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H).
13-035		0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.44 (sextet, $J = 7.5$ Hz, 2H), 1.60-1.70 (m, 2H), 1.69-1.80 (m, 2H), 1.83-1.93 (m, 2H), 2.62 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.75 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.89-3.98 (m, 2H), 4.00-4.08 (m, 2H), 5.25-5.32 (m, 1H), 7.27-7.43 (m, 5H), 8.27 (s, 1H), 10.75 (d, $J = 5.4$ Hz, 1H).
13-036		0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.45 (sextet, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.62-1.78 (m, 4H), 1.83-1.93 (m, 2H), 2.61 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 2.75 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.91 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 4.06 (t, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.50-5.58 (m, 1H), 7.27-7.45 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.75 (t, $J = 7.5$ Hz, 1H).

表 1 4 9

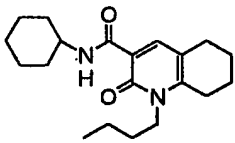
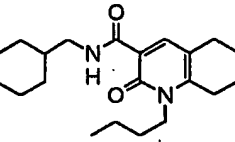
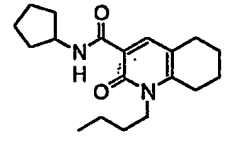
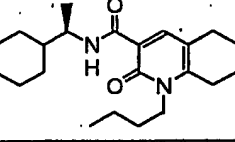
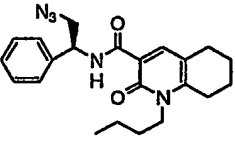
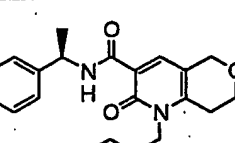
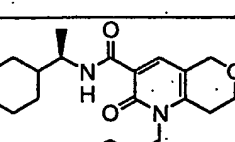
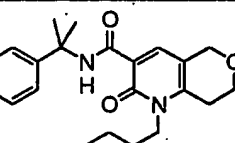
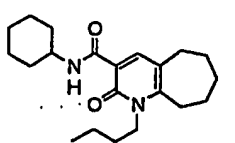
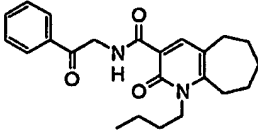
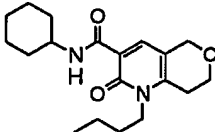
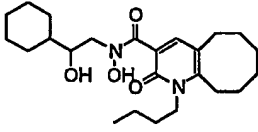
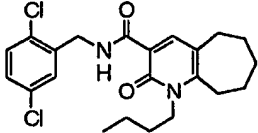
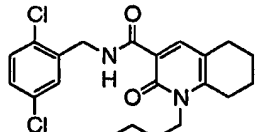
化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
13-037		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.18-1.51 (m, 8H), 1.61-1.77 (m, 6H), 1.83-1.92 (m, 2H), 1.96-2.02 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.90-4.01 (m, 1H), 4.03 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 8.24 (s, 1H), 9.86 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
13-038		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.13-1.30 (m, 2H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.59-1.92 (m, 15H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.28 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.04 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.25 (s, 1H), 9.96 (br s, 1H).
13-039		0.98 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.44 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.52-1.78 (m, 10H), 1.82-1.91 (m, 2H), 1.99-2.11 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.02 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.36 (sextet, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 9.91 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).
13-040		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.05-1.29 (m, 6H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.59-1.92 (m, 11H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.73 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.93-4.13 (m, 1H+2H), 8.24 (s, 1H), 9.85 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
13-041		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.60-1.78 (m, 4H), 1.83-1.91 (m, 2H), 2.61 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.75 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.70 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.06 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 5.38-5.46 (m, 1H), 7.26-7.45 (m, 5H), 8.23 (s, 1H), 10.73 (t, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H).
13-042		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.68 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.58 (s, 2H), 5.29 (quint, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.23-7.42 (m, 5H), 8.17 (s, 1H), 10.25 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H).
13-043		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.03-1.30 (m, 4H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.60-1.84 (m, 9H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.92-4.13 (m, 5H), 4.59 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 9.77 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H).
13-044		1.01 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.71 (quint, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 1.79 (s, 6H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.00 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 4.54 (s, 2H), 7.26-7.34 (m, 3H), 7.42-7.46 (m, 2H), 8.11 (s, 1H), 10.34 (br s, 1H).
13-045		0.99 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H), 1.19-1.52 (m, 8H), 1.62-1.79 (m, 8H), 1.80-1.88 (m, 2H), 1.91-2.02 (m, 2H), 2.71 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.93-4.02 (m, 1H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 9.86 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H).

表 1 5 0

化合物 No.	構造	¹ H-NMR (CDCl ₃)
13-046		1.00 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.74 (m, 6H), 1.83-1.90 (m, 2H), 2.72 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.23 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.96 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 2H), 7.50 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 7.61 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 2H), 8.29 (s, 1H), 10.79 (br s, 1H).
13-047		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.22-1.49 (m, 6H), 1.60-1.78 (m, 6H), 1.94-2.01 (m, 2H), 2.82 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.91-4.05 (m, 5H), 4.60 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 9.79 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H).
13-048		0.98 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.10-1.29 (m, 6H), 1.40-1.56 (m, 8H), 1.65-1.82 (m, 8H), 1.93 (br t, <i>J</i> = 12.0 Hz, 1H), 2.66 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.93 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 3.78-3.87 (m, 2H), 4.00-4.12 (m, 1H), 4.16 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 7.29 (br s, 1H), 8.00 (s, 1H).
13-049		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.46 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.61-1.73 (m, 6H), 1.87 (sextet, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.74 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.96 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.19 (br t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.23-7.29 (m, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 10.43 (br s, 1H).
13-050		0.99 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.45 (sextet, <i>J</i> = 7.2 Hz, 2H), 1.63-1.79 (m, 4H), 1.89 (quint, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.63 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 2.76 (t, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.05 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.68 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2.4 Hz, 1H), 7.25-7.29 (m, 1H), 7.38 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 10.44 (br s, 1H).

試験例

上記化合物を使用して、以下の試験を行った。

試験例 1 ヒトカンナビノイド受容体結合阻害実験

- 5 ヒトカンナビノイド受容体は、CB1 又は CB2 受容体を安定発現させた CHO 細胞の膜画分を用いた。調製した膜標品と被検化合物、及び 38,000 dpm の [³H]CP55940 (終濃度 0.5 nM : NEN Life Science Products 社製) をアッセイ緩衝液 (0.5% 牛血清アルブミンを含む 50 mM Tris-HCl 緩衝液 (pH 7.4)、1 mM EDTA、3 mM MgCl₂) 中で、25°C、2 時間のインキュベーションを行なった。インキュベーションの後、1% ポリエチレンイミン処理したガラスフィルターにて濾過、0.1% BSA を含む 50 mM Tris-HCl 緩衝液 (pH 7.4) にて洗浄後、液体シンチレーションカウンターにてガラスフィルター上の放射活性を求めた。非特異的結合は 10 μM の WIN55212-2 (US 5081122 記載のカンナビノイド受容体アゴニスト、Sigma 社製) 存在下で測定し、特異的結合に対する被検化合物の 50% 阻害濃度 (IC₅₀ 値) を求めた。被検化合物の K_i 値は、得られた IC₅₀ 値と [³H]CP55940 の K_d 値から算出した。

表 1 5 1

化合物	K _i (nM)	
	CB1受容体	CB2受容体
l-5	>5000	61
l-23	>5000	29
l-50	>5000	39
l-51	n.t.	23
l-52	n.t.	35
l-56	n.t.	54
l-6	>5000	9
l-57	4134	6
l-69	n.t.	33
l-60	2097	18
l-62	n.t.	44
l-63	n.t.	43
l-74	n.t.	48

I-77	n.t.	53
I-84	>5000	35
I-85	n.t.	25
n.t.: not tested		

表 1 5 2

化合物	Ki (nM)	
	CB1受容体	CB2受容体
II-13	n.t.	6
II-14	>5000	2
II-17	n.t.	8
II-39	906	2
II-40	n.t.	0.5
II-41	n.t.	1
II-42	>5000	0.3
II-44	321	1.1
II-45	386	1.2
II-46	3226	2
II-49	1116	2.9
II-74	704	1.2
II-78	1015	8
II-80	>5000	2.2
II-88	n.t.	8
II-89	n.t.	8
II-92	1312	6
II-93	1537	3
n.t.: not tested		

表 1 5 3

化合物	Ki (nM)		化合物	Ki (nM)	
	CB1受容体	CB2受容体		CB1受容体	CB2受容体
2-004	nt	101	4-062	>5000	4
3-010	nt	57	4-101	890	1.5
3-038	1252	12	4-102	908	1.6
4-001	2851	28	4-104	54	6
4-002	746	17	4-105	91	2.1
4-003	680	44	4-301	1769	8
4-052	1497	24	4-302	>5000	10
4-053	254	6	4-310	512	9
4-054	482	6	5-005	391	16
4-056	551	8	5-006	390	14
4-061	124	2.5			

試験例2 カンナビノイド受容体を介する cAMP 生成阻害実験

- 5 ヒト CB1 又は CB2 受容体を発現させた CHO 細胞に、被検化合物を添加し 15 分間インキュベーションの後、フォルスコリン（終濃度 4 μ M、SIGMA 社）を加えて 20 分間インキュベーションした。1N HCl を添加して反応を停止させた後、上清中の cAMP 量を Cyclic AMP kit (シーアイエス ダイアグノスティック社製) を用いて測定した。フォルスコリン刺激による cAMP 生成をフォルスコリン無刺激に対して 100%とし、50%の抑制作用を示す被検化合物の濃度 (IC₅₀ 値) を求めた。表に示すとおり、被検化合物は、CB1 又は CB2 受容体に対してアゴニスト作用を示した。
- 10

表 1 5 4

化合物	CB2受容体 IC ₅₀ (nM)
I-5	6.5
I-23	2.6
I-51	2.8
I-6	2.7
I-57	5.5

表 1 5 5

化合物	CB2受容体 IC ₅₀ (nM)
I-46	5.4
I-39	13.7
I-49	2.2
I-74	1.6
I-92	<0.2
I-93	0.6

5 表 1 5 6

化合物	CB2受容体 IC ₅₀ (nM)
3-038	28.6
4-001	64.2
4-053	7.9
4-054	4.2
4-056	4.3
4-061	2.3
4-062	1.3
4-101	1.4
4-102	1.7
4-104	9.8

表 1 5 7

化合物	CB1 受容体 IC ₅₀ (nM)
3-109	2.7
11-001	1.2
11-002	0.4
13-006	1.6
11-011	0.6
11-012	7.8
11-013	7.5
13-023	0.3
10-041	3.5
10-045	1.2
13-030	0.7
10-050	2.0
10-058	2.4
10-059	6.1
13-044	1.8
10-089	9.4
10-103	6.3

本発明化合物について、さらに試験例 3、4 及び 5 を行った。

試験例 3 マウスカンナビノイド受容体結合阻害実験

- 5 マウスカンナビノイド受容体は、CB1 及び CB2 受容体が豊富に存在する組織として、それぞれマウス脳膜画分及び脾臓膜画分を用いた(C57BL/6J マウス)。受容体結合阻害実験は、試験例 1 に示す方法に順じて行なった。

試験例 4 ICR 系マウスにおける Compound 48/80 誘発痒みに対する抑制効果

- 10 Inagaki らの方法 (Eur J Pharmacol 1999;367:361-371)を一部改変して実験を行った。即ち、雌性 ICR 系マウスの予め剃毛した背部に compound 48/80 (3 µg/50 µl/site) を皮内注射して反応を惹起し、その直後から観察される注射部位への後肢での引っ掻き回数を 30 分間に渡ってカウントした。なお、マウスは一度の動作で数回連続して引っ掻くため、その一連の動作を 1 回とカウントした。被検化合物は、ゴ
 15 マ油溶液、又は 0.5%メチルセルローズ懸濁液にて一度に経口投与した後、あらかじめ設定した最高血中濃度が得られる時間に compound 48/80 の接種により痒みを惹起した。痒み抑制の評価は、化合物投与群の引っ掻き回数と媒体投与群におけ

る引っ掻き回数とを比較することにより行った。有意差検定は Dunnett's test で行い、有意水準は 5%とした。表に示すように、マリファナの活性本体である Δ^9 -テトラヒドロカンナビノール、及びカンナビノイド受容体にアゴニスト作用を示す基本骨格の異なる 3 系統の披検化合物は、compound 48/80 によって誘発される

5 痒みを抑制した。

表 1 5 8

化合物	結合試験:Ki値(nM)		cAMP抑制: IC50(nM)		抗搔痒効果(%)
	脳(CB1)	脾臓 (CB2)	CB1	CB2	100 mg/kg(p.o.)
I-270	80	1.2	68.7	7.9	98**
II-86	12	1.1	16.8	1	98**
4-101	35	0.6	60.3	1.4	81**
10-035	12	0.1	29.0	0.2	93**
WIN55212- 2	7	6	12.2	1.1	70*
THC	40	9.2	11.4	6.6	98***#

*p<0.05, **p<0.01, # 10mg/kg(i.p.)

試験例 5 カンナビノイド受容体アゴニストの痒み抑制作用に対する拮抗実験

10 上記の実施例で認められた compound 48/80 誘発痒みに対する披検化合物の抑制作用について、公知のカンナビノイド 1 型受容体アンタゴニストの SR141716A と、2 型受容体アンタゴニストの SR144528 を用いることにより、その受容体特異性について評価を行なった。評価は、SR141716A 又は SR144528 のそれぞれを披検化合物の投与の 1 時間前にマウスに経口投与した後、実施例 1 と同様の方

15 法で披検化合物の compound 48/80 誘発痒みに対する効果を検討した。有意差検定は Welch's t-test で行い、有意水準は 5%とした。図 1 に示すように、I-270 の compound 48/80 誘発痒みに対する抑制効果は、カンナビノイド 1 型受容体アンタゴニストの SR141716A によって拮抗された。このことから、CB1 受容体を介して痒み抑制作用が発揮されていることが確認された。

また、CB2 受容体への選択性が高い化合物による抗搔痒作用は、カンナビノイド 2 型受容体アンタゴニストの SR144528 によって拮抗されることも、上記同様に確認した。このことから、CB2 受容体を介しても抗搔痒作用が発揮されることが確認された。

- 5 これらの結果は、CB1 及び／又は CB2 受容体アゴニストが、抗搔痒剤（かゆみの抑制剤）として有効であることを示すものである。

製剤例

- 以下に示す製剤例 1～8 は例示にすぎないものであり、発明の範囲を何ら限定
10 することを意図するものではない。「活性成分」なる用語は、本発明化合物、その互変異性体、それらのプロドラッグ、それらの製薬的に許容される塩またはそれらの溶媒和物を意味する。

製剤例 1

硬質ゼラチンカプセルは次の成分を用いて製造する：

15		用量
		<u>(mg / カプセル)</u>
	活性成分	2 5 0
	デンプン（乾燥）	2 0 0
	ステアリン酸マグネシウム	<u>1 0</u>
20	合計	4 6 0 mg

製剤例 2

錠剤は下記の成分を用いて製造する：

		用量
		<u>(mg / 錠剤)</u>
25	活性成分	2 5 0
	セルロース（微結晶）	4 0 0
	二酸化ケイ素（ヒューム）	1 0

ステアリン酸	<u>5</u>
合計	6 6 5 m g

成分を混合し、圧縮して各重量 6 6 5 m g の錠剤にする。

製剤例 3

- 5 以下の成分を含有するエアロゾル溶液を製造する：

	<u>重量</u>
活性成分	0 . 2 5
エタノール	2 5 . 7 5
プロペラント 2 2 (クロロジフルオロメタン)	<u>7 4 . 0 0</u>
10 合計	1 0 0 . 0 0

活性成分とエタノールを混合し、この混合物をプロペラント 2 2 の一部に加え、
- 3 0 °C に冷却し、充填装置に移す。ついで必要量をステンレススチール容器へ
供給し、残りのプロペラントで希釈する。バブルユニットを容器に取り付ける。

製剤例 4

- 15 活性成分 6 0 m g を含む錠剤は次のように製造する：

	活性成分	6 0 m g
	デンプン	4 5 m g
	微結晶性セルロース	3 5 m g
	ポリビニルピロリドン (水中 1 0 % 溶液)	4 m g
20	ナトリウムカルボキシメチルデンプン	4 . 5 m g
	ステアリン酸マグネシウム	0 . 5 m g
	滑石	<u>1 m g</u>
	合計	1 5 0 m g

- 25 活性成分、デンプン、およびセルロースは No. 45 メッシュ U. S. のふる
いにかけて、十分に混合する。ポリビニルピロリドンを含む水溶液を得られた粉
末と混合し、ついで混合物を No. 14 メッシュ U. S. ふるいに通す。このよ
うにして得た顆粒を 5 0 °C で乾燥して No. 18 メッシュ U. S. ふるいに通す。

あらかじめN o . 6 0 メッシュU . S . のふるいに通したナトリウムカルボキシメチルデンプン、ステアリン酸マグネシウム、および滑石をこの顆粒に加え、混合した後、打錠機で圧縮して各重量1 5 0 m g の錠剤を得る。

製剤例 5

- 5 活性成分 8 0 m g を含むカプセル剤は次のように製造する：

活性成分	8 0 m g
デンプン	5 9 m g
微結晶性セルロース	5 9 m g
ステアリン酸マグネシウム	<u>2 m g</u>

- 10 合計 2 0 0 m g

活性成分、デンプン、セルロース、およびステアリン酸マグネシウムを混合し、N o . 4 5 メッシュU . S . のふるいを通して硬質ゼラチンカプセルに2 0 0 m g ずつ充填する。

製剤例 6

- 15 活性成分 2 2 5 m g を含む坐剤は次のように製造する：

活性成分	2 2 5 m g
飽和脂肪酸グリセリド	<u>2 0 0 0 m g</u>
合計	2 2 2 5 m g

- 20 活性成分をN o . 6 0 メッシュU . S . のふるいを通し、あらかじめ必要最小限に加熱して融解させた飽和脂肪酸グリセリドに懸濁する。ついでこの混合物を、みかけ2 g の型に入れて冷却する。

製剤例 7

活性成分 5 0 m g を含む懸濁剤は次のように製造する：

- | | | |
|----|--------------------|-------------|
| 25 | 活性成分 | 5 0 m g |
| | ナトリウムカルボキシメチルセルロース | 5 0 m g |
| | シロップ | 1 . 2 5 m l |
| | 安息香酸溶液 | 0 . 1 0 m l |

香料	q . v .
色素	q . v .
精製水を加え合計	5 m l

- 5 活性成分を N o . 4 5 メッシュ U . S . のふるいにかけて、ナトリウムカルボキシメチルセルロースおよびシロップと混合して滑らかなペーストにする。安息香酸溶液および香料を水の一部で希釈して加え、攪拌する。ついで水を十分量加えて必要な体積にする。

製剤例 8

静脈用製剤は次のように製造する：

10	活性成分	1 0 0 m g
	飽和脂肪酸グリセリド	1 0 0 0 m l

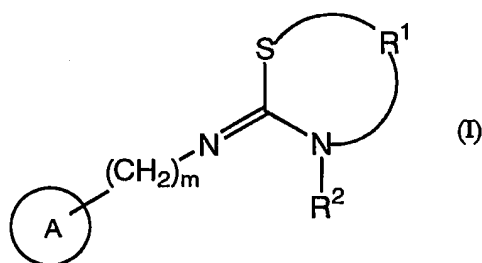
上記成分の溶液は通常、1 分間に 1 m l の速度で患者に静脈内投与される。

産業上の利用の可能性

- 15 カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物により、痒みを抑制することができる。

請求の範囲

1. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物、そのプロドラッグ、
それらの製薬上許容される塩、又はそれらの溶媒和物を有効成分として含有する
5 抗搔痒剤。
2. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、カンナビノイド
1型受容体アゴニスト作用を有する化合物である請求の範囲第1項記載の抗搔痒
剤。
3. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、カンナビノイド
10 2型受容体アゴニスト作用を有する化合物である請求の範囲第1項記載の抗搔痒
剤。
4. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、カンナビノイド
1型受容体アゴニスト作用及びカンナビノイド2型受容体アゴニスト作用を有す
る化合物である請求の範囲第1項記載の抗搔痒剤。
- 15 5. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、式 (I) :



(式中、 R^1 は置換されていてもよいアルキレンであり；

R^2 はアルキル、式： $-C(=R^3)-R^4$ (式中、 R^3 はO又はSであり、 R^4
はアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、置換されていてもよ
いアミノ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアラ
20 ルキルチオ、置換されていてもよいアラルキルアミノ、アルコキシアルキル、ア
ルキルチオアルキル又は置換されていてもよいアミノアルキルを表わす) で示さ
れる基又は式： $-SO_2R^5$ (式中、 R^5 はアルキル、置換されていてもよいアミ

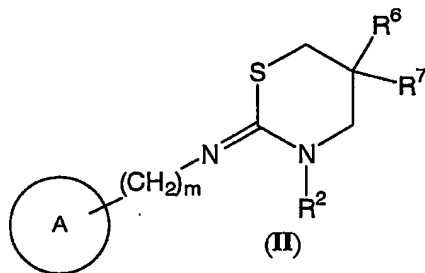
ノ、置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよい芳香族複素環式基を表わす)で示される基であり；

mは0～2の整数であり；

Aは置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよい芳香族複素環式基である)で示される化合物群から選択されるものである請求の範囲第1項記載の抗搔痒剤。

6. R^1 がアルキレンで置換されていてもよい炭素数2～9の直鎖状又は分枝状のアルキレンであり； R^2 が式： $-C(=R^3)-R^4$ (式中、 R^3 はO又はSであり、 R^4 がアルコキシ、アルキルチオ又はアルケニルチオである)で示される基であり；mが0であり；Aがアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びアルキルチオからなる群から選択される基で1～2箇所置換されていてもよいアリールである請求の範囲第5項記載の抗搔痒剤。

7. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、式(II)：



(式中、 R^2 は置換されていてもよい複素環式基又は式： $-C(=Z)W-R^8$ (式中、ZはO又はS；WはO又はS； R^8 は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル又は置換されていてもよいアルキニル)で示される基であり；

R^6 及び R^7 はそれぞれ独立して水素原子、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルコキシアルキル、置換されていてもよいアミノアルキル又は置換されていてもよいシクロアルキル；又は

R^6 及び R^7 は一緒になって置換されていてもよいヘテロ原子を含んでいてもよいアルキレンであり；

mは0～2の整数であり；

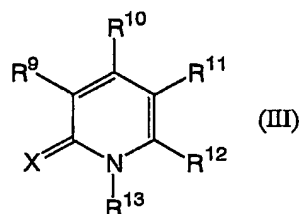
Aは置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよい芳香族複素環式基である）で示される化合物群から選択されるものである請求の範囲第1項記載の抗搔痒剤。

- 5 8. mが0であり；Aがアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びアルキルチオからなる群から選択される基で1～2箇所置換されていてもよいアリールである請求の範囲第7項記載の抗搔痒剤。

9. R^2 が式： $-C(=Z)W-R^8$ （式中、ZはO又はS；WはO又はS； R^8 は置換されていてもよいアルキル又は置換されていてもよいアルケニル）で示さ

- 10 れる基であり； R^6 及び R^7 がそれぞれ独立して置換されていてもよいアルキル、又は一緒になって置換されていてもよいヘテロ原子を含んでいてもよいアルキレンである請求の範囲第7項又は第8項記載の抗搔痒剤。

10. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物が、式（III）：



- 15 （式中、 R^9 は水素、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$ （式中、 Y^1 及び Y^3 はそれぞれ独立して単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； Y^2 は単結合、 $-O-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、 $-O-C(=O)-O-$ 、 $-O-C(=O)-NR^b-$ 、 $-O-SO_2-$ 、 $-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=O)-$ 、 $-NR^b-SO_2-$ 、 $-NR^b-C(=NH)-$ 、 $-NR^b-C(=O)-O-$ 、 $-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=O)-NR^b-SO_2-$ 、 $-NR^b-C(=S)-$ 、 $-NR^b$
- 20

$-C(=S)-NR^b-$ 、 $-NR^b-SO_2-NR^b-$ 、 $-NR^b-C(=NH)-NR^b-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-O-$ 、 $-SO_2-NR^b-$ 、 $-SO_2-NR^b-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=S)-$ 、 $-C(=S)-NR^b-$ 、 $-C(=S)-NR^b-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-NR^b-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NR^b-C(=NR^b)-$ 又は $-C(=O)-NR^b-NR^b-$ であり； R^a は置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルであり； R^b はそれぞれ独立して水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基、アシル、ヒドロキシ又はアルコキシである）で示される基であり；

R^{10} は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^4-R^c$ （式中、 Y^4 は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり； R^c は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；

R^{11} 及び R^{12} はそれぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、ハロゲン、シアノ、ホルミル、アシル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、イソチオシアナト、置換されていてもよいアミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ア

ルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ニトロ又は式： $-Y^6-R^d$ （式中、 Y^6 は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-E-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり；Eは単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； R^d は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；

R^{13} は水素、ヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキル又は式： $-Y^6-R^e$ （式中、 Y^6 は単結合、置換されていてもよいアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NH-E-$ 又は $-NH-C(=O)-$ であり；Eは単結合又は置換されていてもよいアルキレンであり； R^e は置換されていてもよい炭素環式基又は置換されていてもよい複素環式基である）で示される基であり；

又は、 R^{10} 及び R^{11} の組合わせ、 R^{11} 及び R^{12} の組合わせ、 R^{12} 及び R^{13} の組合わせのいずれか一つの組合わせが一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成していてもよく；

XはS又はOである）で示される化合物群から選択されるものである請求の範囲第1項記載の抗搔痒剤。

11. R^9 が式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$ （式中、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 及び R^b は請求の範囲第10項と同意義であり； R^a は置換されていてもよい炭素環式基、置換されていてもよい複素環式基又はアシルである）で示される基であり； R^{10} が水素又は置換されていてもよいアルキルであり； R^{11} が置換されていてもよいアルキル、ハロゲン又は式： $-Y^6-R^d$ （式中、 Y^6 は単結合又はアルキニレンであり； R^d は請求の範囲第10項と同意義である）で示される基であり； R^{12} が水素又は置換されていてもよいアルキルであり； R^{13} がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい炭素数3以上のアルキル

又は式： $-Y^6-R^6$ （式中、 Y^6 及び R^6 は請求の範囲第10項と同意義である）で示される基であり；又は、 R^{11} 及び R^{12} は一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい環を形成していてもよい請求の範囲第10項記載の抗搔痒剤。

- 5 12. R^9 が式： $-Y^1-Y^2-Y^3-R^a$ （式中、 Y^1 は単結合であり； Y^2 は $-C(=O)-NH-$ であり； Y^3 は単結合又は置換されていてもよいアルキルであり； R^a は置換されていてもよい炭素環式基又はアシルである）で示される基であり；

R^{10} が水素であり；

- 10 R^{11} 及び R^{12} が一緒になって、隣接する原子と共にヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよい環を形成し；

R^{13} がヘテロ原子及び／又は不飽和結合が介在していてもよい置換されていてもよいアルキルであり；

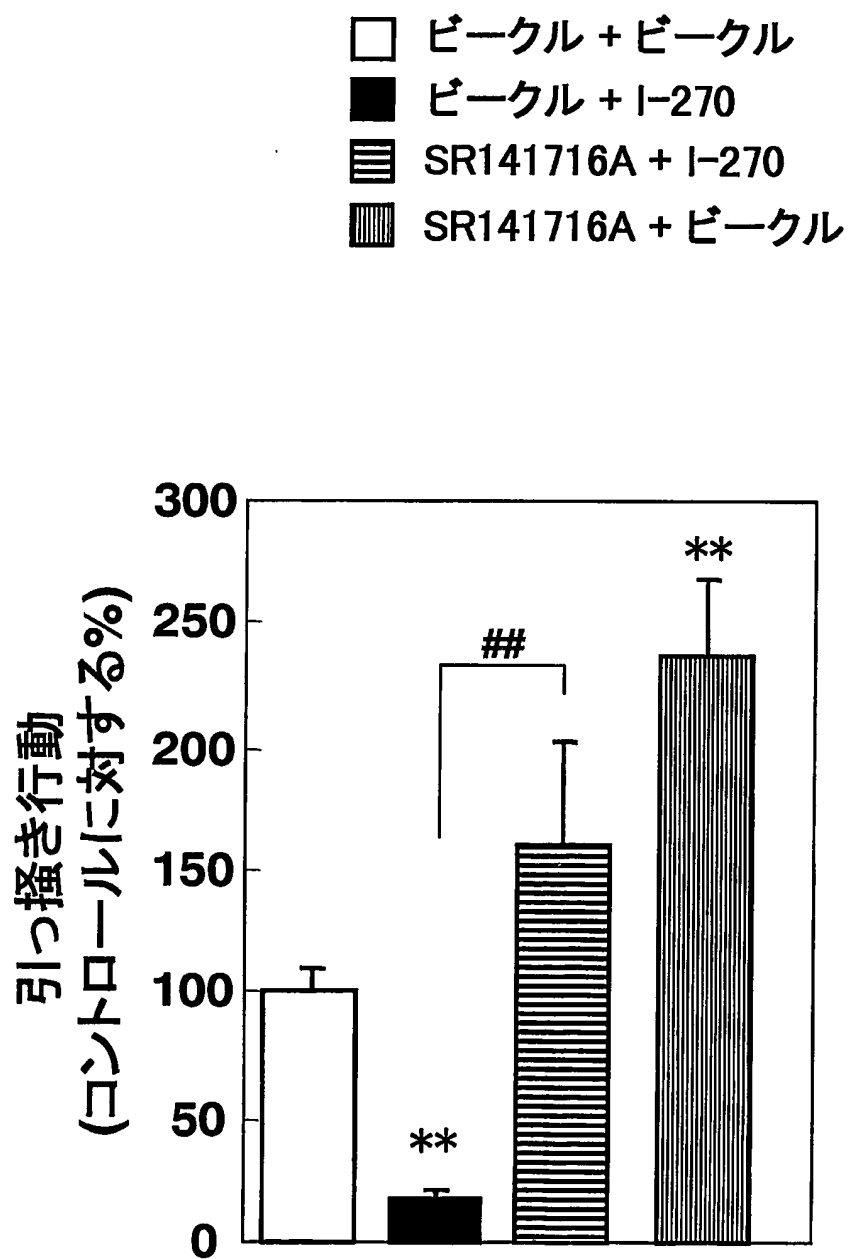
XがS又はOである請求の範囲第10項記載の抗搔痒剤。

- 15 13. カンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩、又はそれらの溶媒和物を投与することを特徴とする搔痒の治療方法。

14. 抗搔痒剤を製造するためのカンナビノイド受容体アゴニスト作用を有する化合物、そのプロドラッグ、それらの製薬上許容される塩、又はそれらの溶媒

- 20 和物の使用。

図 1



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/01725

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl. ⁷ A61K45/00, 31/426, 31/435, 31/436, 31/4375, 31/4412, 31/4427, 31/4439, 31/4523, 31/4704, 31/4709, 31/4745, 31/506, 31/5377, 31/54, 31/541, 31/5415, 31/547, A61P17/04 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl. ⁷ A61K45/00, 31/33-31/655, A61P17/04 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2003 Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2003 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2003 Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS (STN), MEDLINE (STN), REGISTRY (STN), EMBASE (STN), BIOSIS (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
E, X	US 2002/0182159 A1 (UNILEVER HOME & PERSONAL CARE USA, DIVISION OF CONOPCO, INC.), 05 December, 2002 (05.12.02), Full text; particularly, examples 1 to 3 & WO 02/65997 A1	1-12, 14
E, A	WO 02/053543 A1 (Shionogi & Co., Ltd.), 11 July, 2002 (11.07.02), Full text (Family: none)	1-4, 10-12, 14
A	WO 01/19807 A1 (Shionogi & Co., Ltd.), 22 March, 2001 (22.03.01), Full text & EP 1219612 A1	1-9, 14
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search 06 May, 2003 (06.05.03)		Date of mailing of the international search report 20 May, 2003 (20.05.03)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP03/01725

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	DARMANI, N.A. et al., Cannabinoids of diverse structure inhibit two DOI-induced 5-HT _{2A} receptor-mediated behaviors in mice, Pharmacology, Biochemistry and Behavior, 2001, Vol.68, No.2, pages 311 to 317	1-12,14
A	BUEB, Jean-Luc et al., Receptor-independent effects of natural cannabinoids in rat peritoneal mast cells in vitro, Biochemica et Biophysica Acta, 2001, Vol.1538, Nos.2 to 3, pages 252 to 259	1-12,14

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/01725

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 13

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Claim 13 pertains to methods for treatment of the human body by therapy and thus relates to a subject matter which this International Searching Authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(i) of the PCT and Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K45/00, 31/426, 31/435, 31/436, 31/4375, 31/4412, 31/4427, 31/4439, 31/4523, 31/4704, 31/4709, 31/4745, 31/506, 31/5377, 31/54, 31/541, 31/5415, 31/547, A61P17/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K45/00, 31/33-31/655, A61P17/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報 1922-1996年
 日本国公開実用新案公報 1971-2003年
 日本国登録実用新案公報 1994-2003年
 日本国実用新案登録公報 1996-2003年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN) MEDLINE (STN)
 REGISTRY (STN) EMBASE (STN)
 BIOSIS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
E X	US 2002/0182159 A1 (UNILEVER HOME & PERSONAL CARE USA, DIVISION OF CONOPCO, INC.) 2002.12.05, 全文, 特にEXAMPLE1-3 & WO 02/65997 A1	1-12, 14
E A	WO 02/053543 A1 (塩野義製薬株式会社) 2002.07.11, 全文 (ファミリーなし)	1-4, 10-12, 14
A	WO 01/19807 A1 (塩野義製薬株式会社) 2001.03.22, 全文 & EP 1219612 A1	1-9, 14

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
 「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

06.05.03

国際調査報告の発送日

20.05.03

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
 郵便番号 100-8915
 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

浜田 麻子



4C

2938

電話番号 03-3581-1101 内線 3451

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	DARMANI, N. A. <i>et al</i> , Cannabinoids of diverse structure inhibit two DOI-induced 5-HT _{2A} receptor-mediated behaviors in mice, Pharmacology, Biochemistry and Behavior, 2001, Vol.68, No. 2, pp311-317	1-12, 14
A	BUEB, Jean-Luc <i>et al</i> , Receptor-independent effects of natural cannabinoids in rat peritoneal mast cells in vitro, Biochemica et Biophysica Acta, 2001, Vol.1538, No.2-3, pp252-259	1-12, 14

第Ⅰ欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT 17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 13 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、

請求の範囲13は、治療による人体の処置方法に関するものであって、PCT第17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iv)の規定により、この国際調査機関が国際調査を行うことを要しない対象に係るものである。

2. ☐ 請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3. ☐ 請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。